

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平10-72434

(43) 公開日 平成10年(1998) 3月17日

(51) Int.Cl. ⁶	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 D 207/325			C 0 7 D 207/325	
A 0 1 N 43/36			A 0 1 N 43/36	A
43/50			43/50	A
43/56			43/56	B
43/653			43/653	L

審査請求 未請求 請求項の数 6 O L (全 98 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願平8-282487	(71) 出願人	000003986 日産化学工業株式会社 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1
(22) 出願日	平成8年(1996)10月24日	(72) 発明者	河村 保夫 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社中央研究所内
(31) 優先権主張番号	特願平8-85414	(72) 発明者	北 浩 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社中央研究所内
(32) 優先日	平8(1996)4月8日	(72) 発明者	中田 尚志 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社中央研究所内
(33) 優先権主張国	日本 (J P)		
(31) 優先権主張番号	特願平8-164436		
(32) 優先日	平8(1996)6月25日		
(33) 優先権主張国	日本 (J P)		

最終頁に続く

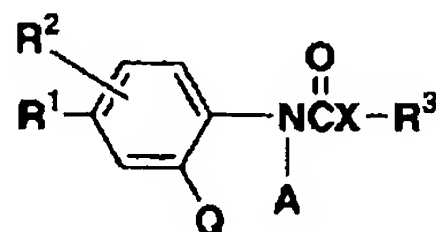
(54) 【発明の名称】 2, 4-置換アニリン誘導体

(57) 【要約】

【課題】 新規な農薬、特に除草剤を提供する。

【解決手段】 式：

【化1】

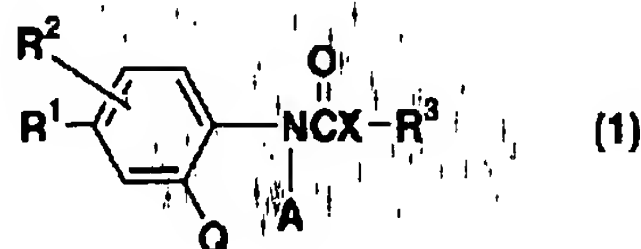


で表される 2, 4-置換アニリン誘導体およびそれを含有する除草剤。式中、R¹はアルキル、ハロアルキルまたはアルコキシなどを表し、R²は水素、アルキルまたはハロアルキルなどを表し、R³はアルキル、シクロアルキルまたはアルケニルなどを表し、Xは酸素、硫黄、NR⁵または単結合を表し、Qはアゾール類などを表す。

BEST AVAILABLE COPY

【請求項1】 式(1)

【化1】



〔式中、 R^1 は $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ $C_1 \sim C_3$ アルキル基、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ $C_1 \sim C_3$ アルキル基、アセチル基またはハロゲン原子を表し、 R^2 は水素原子、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基、 C_1 ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、 C_1 ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基またはシアノ基を表し、Aは水素原子、ホルミル基、($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルボニル基、($C_1 \sim C_4$ ハロアルキル)カルボニル基、($C_1 \sim C_4$ アルコキシ)カルボニル基、($C_2 \sim C_4$ ハロアルコキシ)カルボニル基、($C_2 \sim C_4$ アルケニル)カルボニル基、($C_1 \sim C_4$ アルキルチオ)カルボニル基、($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)カルボニル基、($C_3 \sim C_6$ シクロアルコキシ)カルボニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル基または $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル基を表し、Xは酸素原子、硫黄原子、 NR^5 (R^5 は水素原子または $C_1 \sim C_3$ アルキル基を表す。)または単結合を表し、 R^3 は

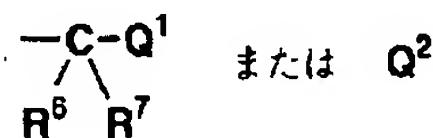
$\sim C_6$ アルケニル基、 $C_5 \sim C_7$ シクロアルケニル基、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ $C_1 \sim C_4$ アルキル基、($C_3 \sim C_7$ シクロアルキル) $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $C_3 \sim C_7$ シクロハロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル基または

【化2】



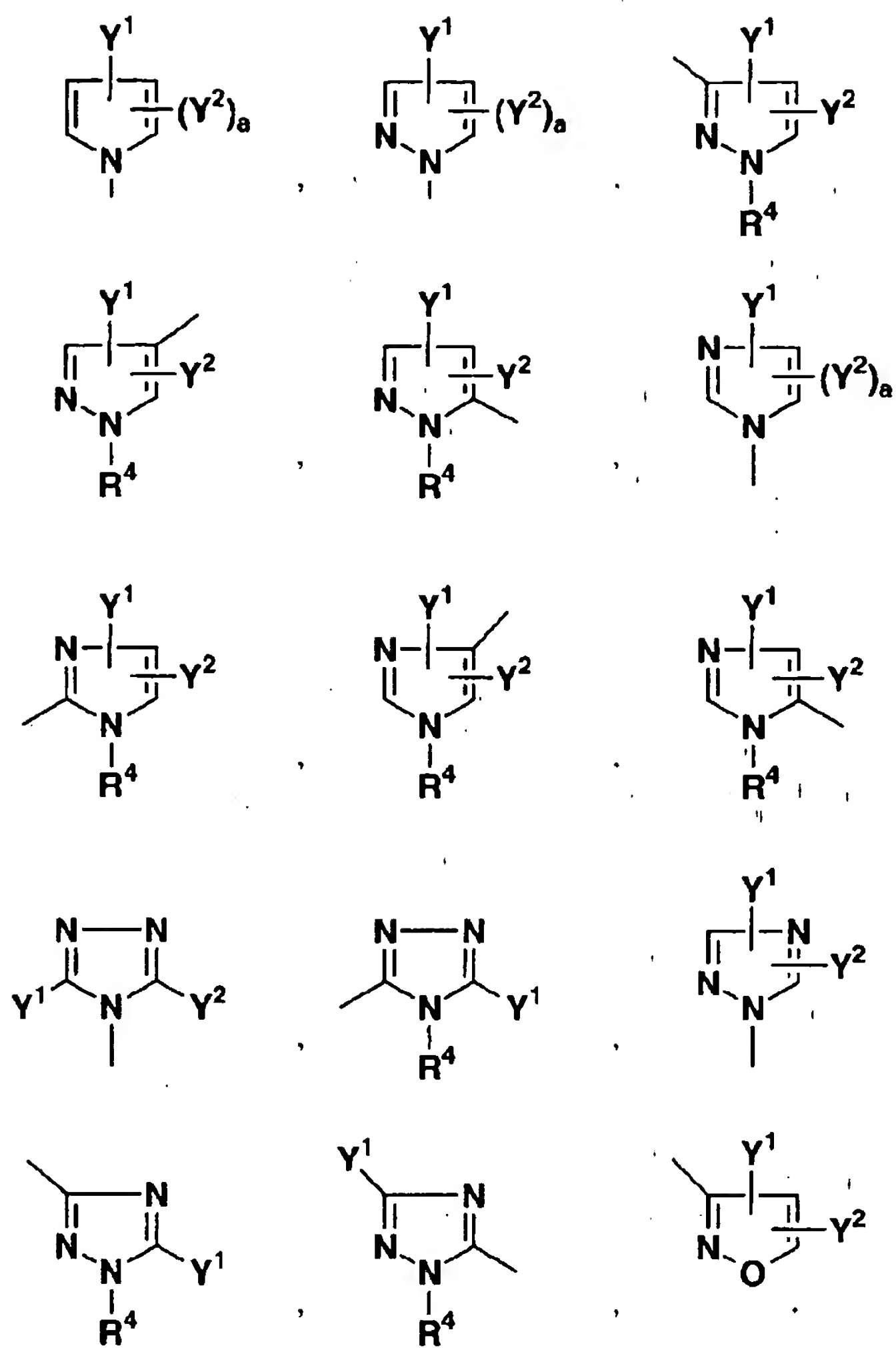
〔式中、Zは $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル基、シアノ基、($C_1 \sim C_4$ アルコキシ)カルボニル基、カルボキシ基またはニトロ基を表し、mは0から5の整数を表し、mが2から5の整数を表す場合、Zは同一でも異なってもよい。〕を表し、Qは

【化3】

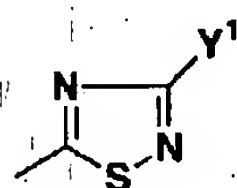
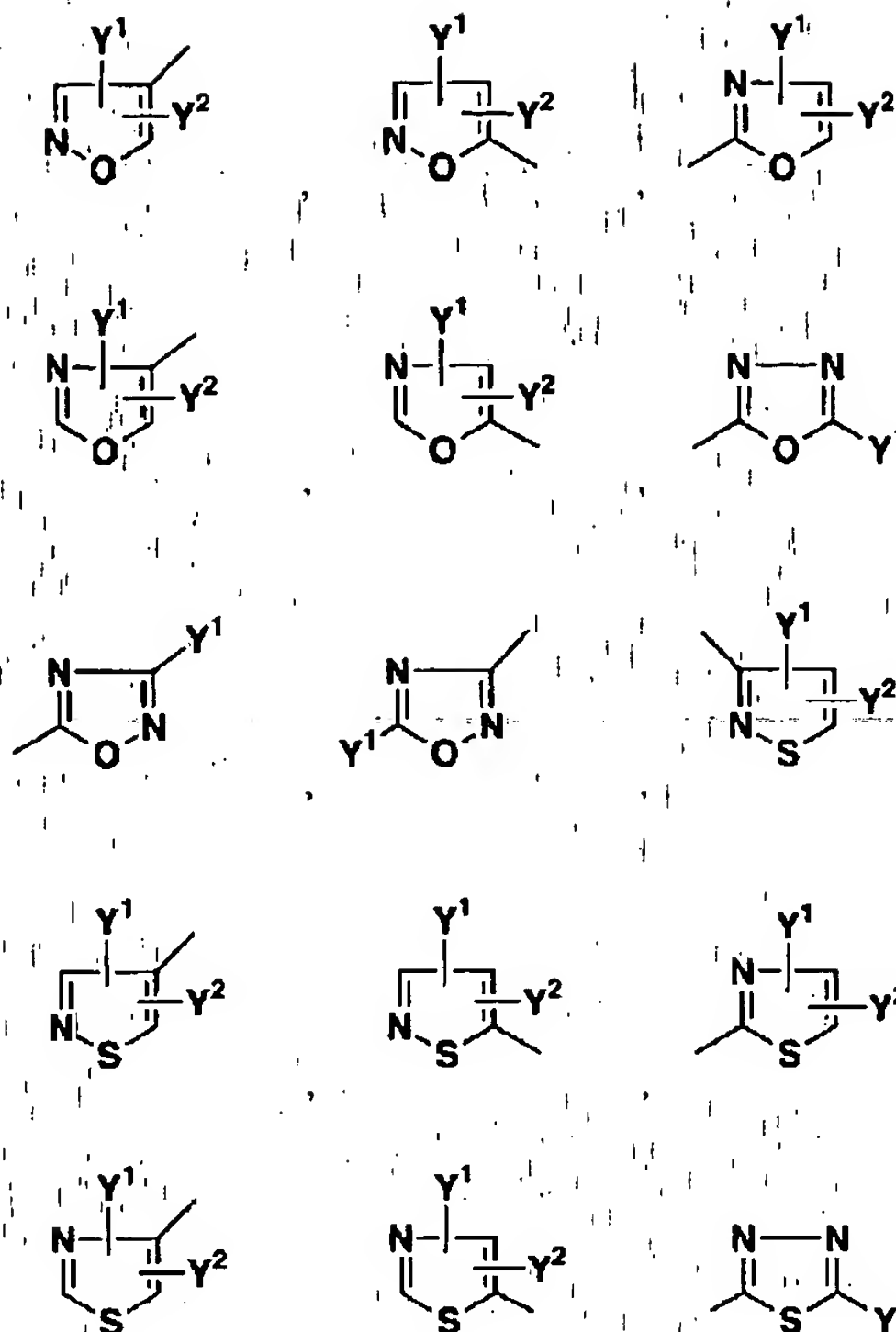


〔式中、 R^6 、 R^7 はそれぞれ独立に水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基を表し、 Q^1 は

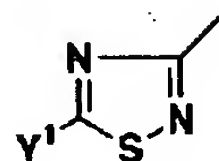
【化4】



【化5】

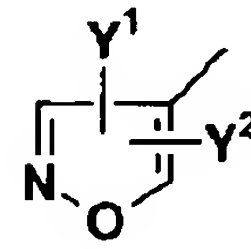
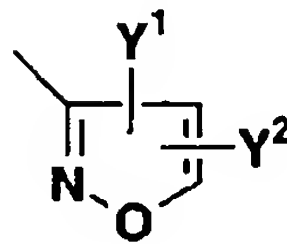
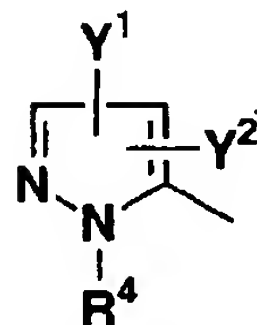
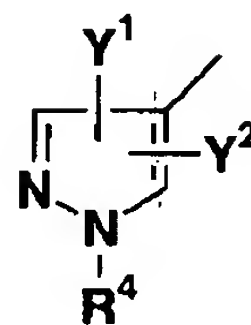
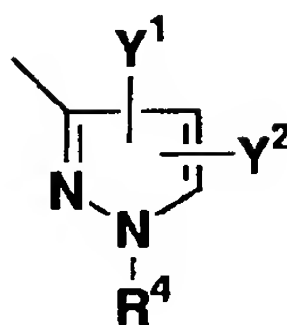
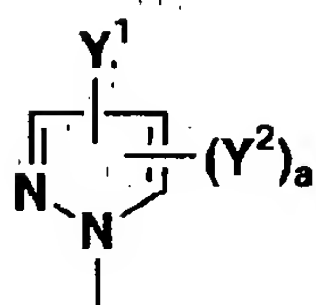


または

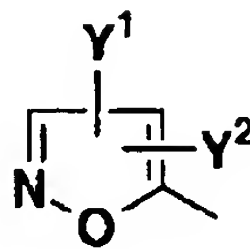


【化6】

を表し、 Q^2 は



または



を表し、 R^4 は水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基を表し、 Y^1 は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、($C_1 \sim C_4$ アルコキシ)カルボニル基またはカルボキシ基を表し、 Y^2 は水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキ

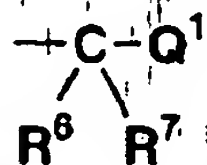
ル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキ

ルスルホニル基、ニトロ基、シアノ基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基またはカルボキシ基を表し、aは1または2を表し、aが2を表す場合、Y²は同一でも異なってもよい。)を表す。)で表される2, 4-置換アニリン誘導体。

【請求項2】 R¹がC₁~C₄アルキル基、C₁~C₄アルコキシ基またはハロゲン原子を表し、R²が水素原子を表す請求項1記載の2, 4-置換アニリン誘導体。

【請求項3】 Qが

【化7】



を表す請求項2記載の2, 4-置換アニリン誘導体。

【請求項4】 QがQ²を表す請求項2記載の2, 4-置換アニリン誘導体。

【請求項5】 請求項1記載の2, 4-置換アニリン誘導体を含有する農薬。

【請求項6】 請求項1記載の2, 4-置換アニリン誘導体を含有する除草剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】本発明は新規な2, 4-置換アニリン誘導体および該化合物を有効成分として含有する農薬、特に除草剤に関するものである。

【0002】

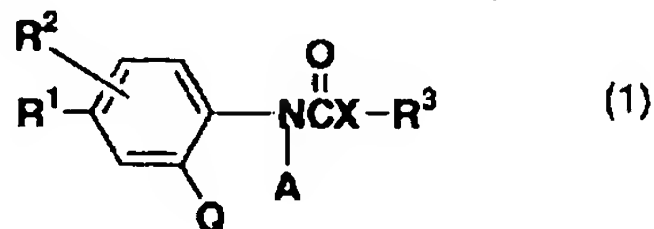
【従来の技術および課題】オルソ位に直接ヘテロ環またはメチレンを経由してヘテロ環を有するアニリン誘導体で除草活性を有する化合物が、WO-9309099およびWO-9509846に記載されている。また殺虫活性を有する化合物が特開平2-91062に、抗菌活性を有する化合物がEur. J. Med. Chem. 23(4), 311-317 (1988)に記載されている。

【0003】

【課題を解決するための手段】本発明は、式(1)：

【0004】

【化8】



【0005】【式中、R¹はC₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₄アルコキシ基、C₁~C₄ハロアルコキシ基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₃アルコキシC₁~C₃アルキル基、C₁~C₃アルキルチオC₁~C₃アルキル基、アセチル基またはハロゲン原子を表し、R²は水素原子、C₁~C₃アルキル基、C₁ハロア

ルキル基、C₁~C₃アルコキシ基、C₁ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基またはシアノ基を表し、Aは水素原子、ホルミル基、(C₁~C₄アルキル)カルボニル基、(C₁~C₄ハロアルキル)カルボニル基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基、(C₂~C₄ハロアルコキシ)カルボニル基、(C₂~C₄アルケニル)カルボニル基、(C₁~C₄アルキルチオ)カルボニル基、(C₃~C₆シクロアルキル)カルボニル基、(C₃~C₆シクロアルコキシ)カルボニル基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₄アルキルスルフィニル基、C₁~C₄アルキルスルホニル基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル基またはC₁~C₄ハロアルキルスルホニル基を表し、Xは酸素原子、硫黄原子、NR⁵(R⁵は水素原子またはC₁~C₃アルキル基を表す。)または単結合を表し、R³はC₁~C₇アルキル基、C₃~C₇シクロアルキル基、C₂~C₆アルケニル基、C₅~C₇シクロアルケニル基、C₁~C₃アルコキシC₁~C₄アルキル基、C₁~C₃アルキルチオC₁~C₄アルキル基、(C₃~C₇シクロアルキル)C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₃~C₇シクロハロアルキル基、C₂~C₆ハロアルケニル基、C₂~C₆アルキニル基、C₂~C₆ハロアルキニル基または

【0006】

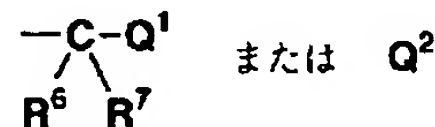
【化9】



【0007】(式中、ZはC₁~C₄アルキル基、ハロゲン原子、C₁~C₄アルコキシ基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₄ハロアルコキシ基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₄アルキルスルフィニル基、C₁~C₄アルキルスルホニル基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル基、シアノ基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基、カルボキシ基またはニトロ基を表し、mは0から5の整数を表し、mが2から5の整数を表す場合、Zは同一でも異なってもよい。)を表し、Qは

【0008】

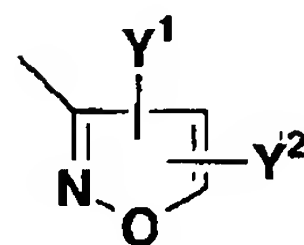
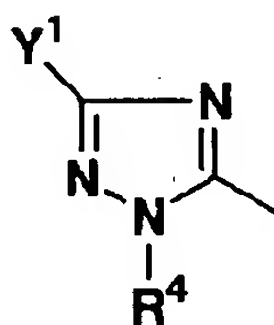
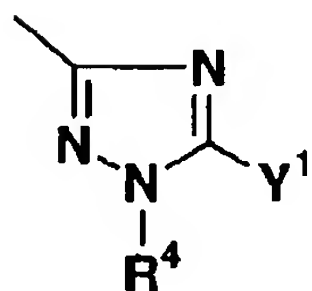
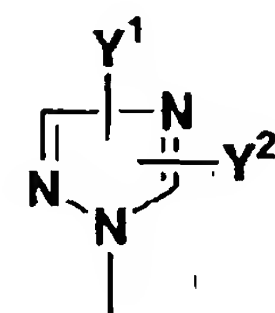
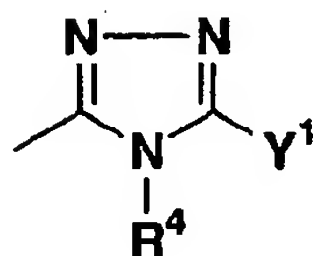
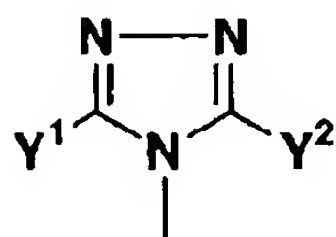
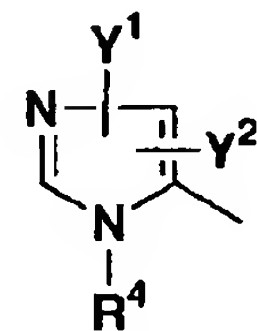
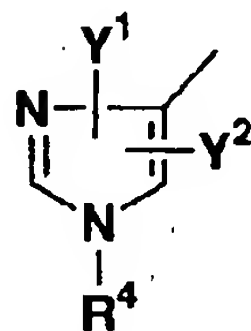
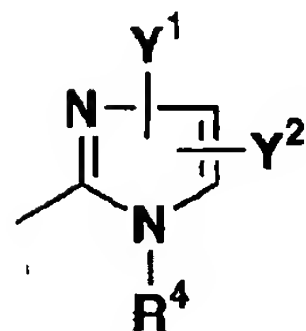
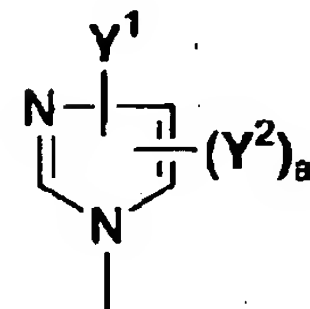
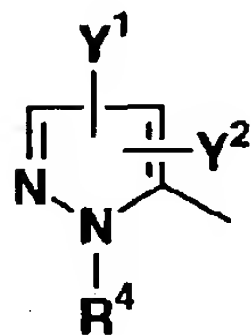
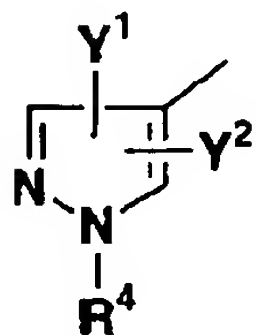
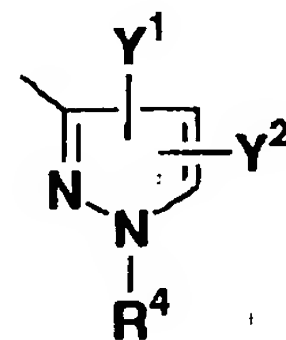
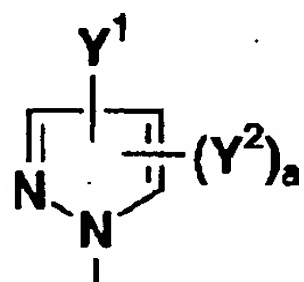
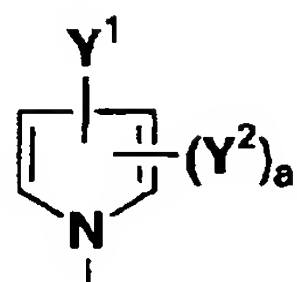
【化10】



【0009】(式中、R⁶、R⁷はそれぞれ独立に水素原子またはC₁~C₄アルキル基を表し、Q¹は

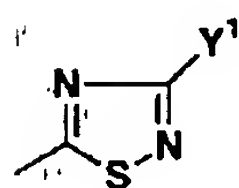
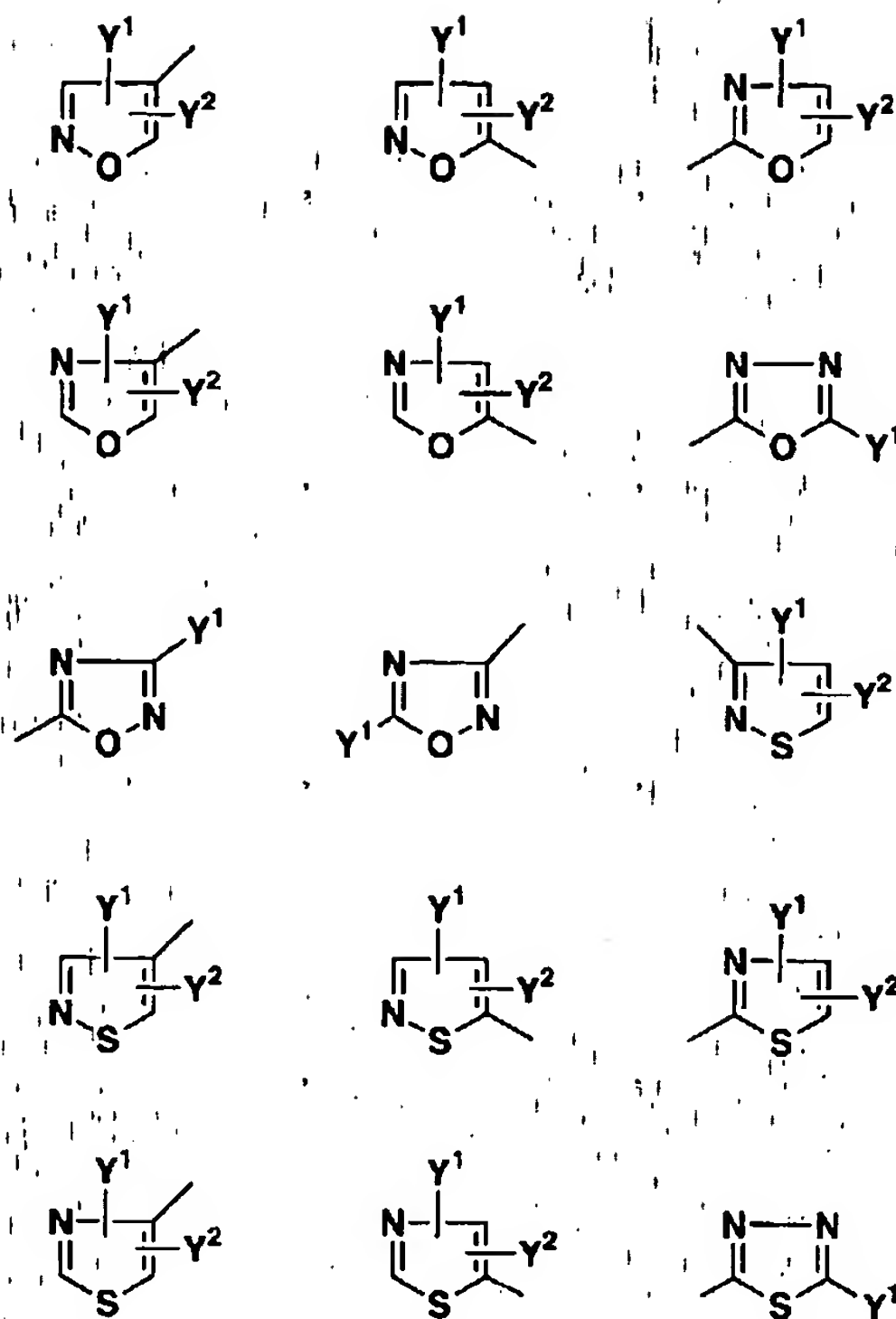
【0010】

【化11】

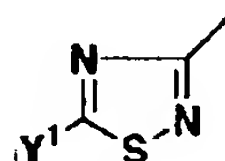


【0011】

【化12】

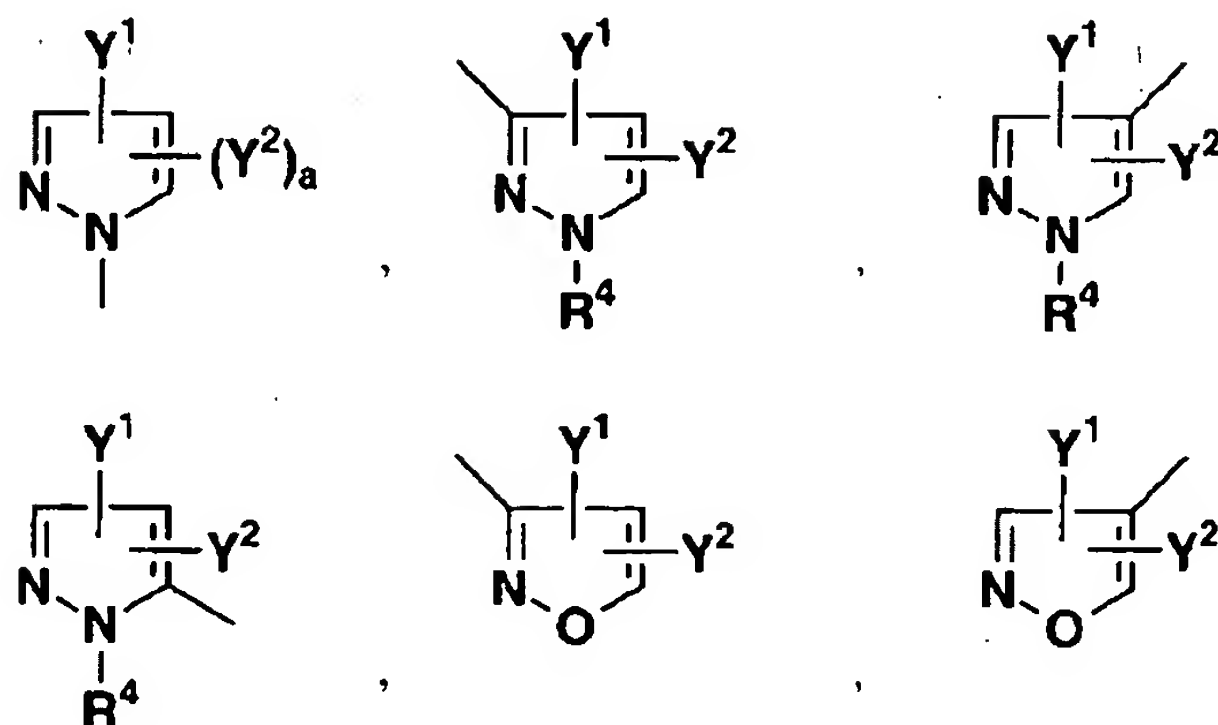


または

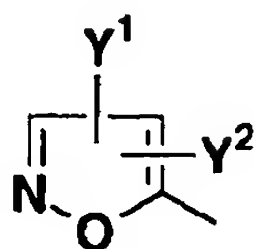


【0012】を表し、 Q^2 は
【0013】

【化13】



または



【0014】を表し、 R^4 は水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基を表し、 Y^1 は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、($C_1 \sim C_4$ アルコキシ)カルボニル基またはカル

ボキシ基を表し、 Y^2 は水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル基、 $C_1 \sim$

C₄アルキルスルホニル基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル基、ニトロ基、シアノ基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基またはカルボキシ基を表し、aは1または2を表し、aが2を表す場合、Y²は同一でも異なってもよい。)を表す。)で表される2, 4-置換アニリン誘導体(以下本発明化合物と称する。)および当該化合物を含有する農薬、特に除草剤である。

【0015】

【発明の実施の形態】以下に、式(1)の置換基をあげる。R¹としては、C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₄アルコキシ基、C₁~C₄ハロアルコキシ基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₃アルコキシC₁~C₃アルキル基、C₁~C₃アルキルチオC₁~C₃アルキル基、アセチル基およびハロゲン原子があげられ、好ましいR¹としては、C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄アルコキシ基およびハロゲン原子があげられる。

【0016】R²としては、水素原子、C₁~C₃アルキル基、C₁ハロアルキル基、C₁~C₃アルコキシ基、C₁ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基およびシアノ基があげられ、好ましいR²としては水素原子があげられる。R³としては、C₁~C₇アルキル基、C₃~C₇シクロアルキル基、C₂~C₆アルケニル基、C₅~C₇シクロアルケニル基、C₁~C₃アルコキシC₁~C₄アルキル基、C₁~C₃アルキルチオC₁~C₄アルキル基、(C₃~C₇シクロアルキル)C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₃~C₇シクロハロアルキル基、C₂~C₆ハロアルケニル基、C₂~C₆アルキニル基、C₂~C₆ハロアルキニル基および

【0017】

【化14】



【0018】(式中、ZはC₁~C₄アルキル基、ハロゲン原子、C₁~C₄アルコキシ基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₄ハロアルコキシ基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₄アルキルスルフィニル基、C₁~C₄アルキルスルホニル基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル基、シアノ基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基、カルボキシ基またはニトロ基を表し、mは0から5の整数を表し、mが2から5の整数を表す場合、Zは同一でも異なってもよい。)があげられ、好ましいR³としては、C₁~C₇アルキル基、C₃~C₇シクロアルキル基、C₂~C₆アルケニル基、C₁~C₃アルコキシC₁~C₄アルキル基、C₁~C₃アルキルチオC₁~

C₄アルキル基、(C₃~C₇シクロアルキル)C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₃~C₇シクロハロアルキル基、C₂~C₆ハロアルケニル基、C₂~C₆アルキニル基および

【0019】

【化15】



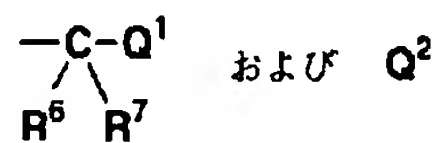
【0020】(式中、ZはC₁~C₄アルキル基、ハロゲン原子、C₁~C₄アルコキシ基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₄ハロアルコキシ基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₄アルキルスルフィニル基、C₁~C₄アルキルスルホニル基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル基、シアノ基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基、カルボキシ基またはニトロ基を表し、mは0から5の整数を表し、mが2から5の整数を表す場合、Zは同一でも異なってもよい。)があげられる。

【0021】Aとしては水素原子、ホルミル基、(C₁~C₄アルキル)カルボニル基、(C₁~C₄ハロアルキル)カルボニル基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基、(C₂~C₄ハロアルコキシ)カルボニル基、(C₂~C₄アルケニル)カルボニル基、(C₁~C₄アルキルチオ)カルボニル基、(C₃~C₆シクロアルキル)カルボニル基、(C₃~C₆シクロアルコキシ)カルボニル基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₄アルキルスルフィニル基、C₁~C₄アルキルスルホニル基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル基およびC₁~C₄ハロアルキルスルホニル基があげられ、好ましいAとしては、水素原子、ホルミル基、(C₁~C₄アルキル)カルボニル基、(C₁~C₄ハロアルキル)カルボニル基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基、(C₂~C₄ハロアルコキシ)カルボニル基、(C₂~C₄アルケニル)カルボニル基、(C₃~C₆シクロアルキル)カルボニル基および(C₃~C₆シクロアルコキシ)カルボニル基があげられる。

【0022】Qとしては

【0023】

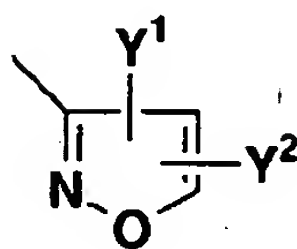
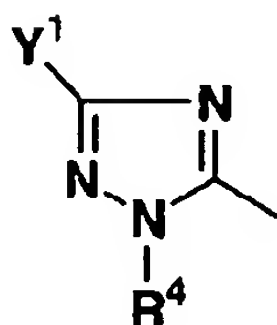
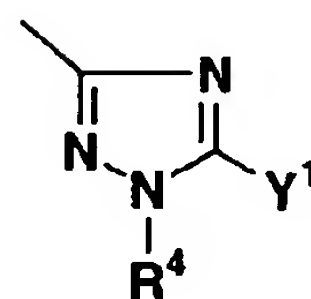
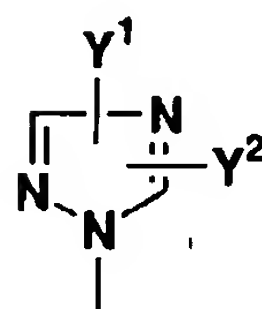
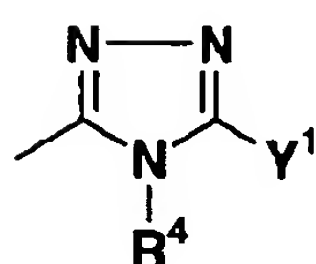
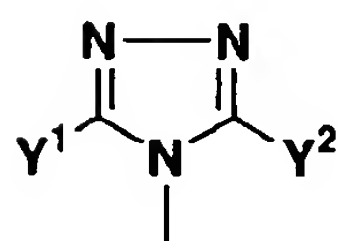
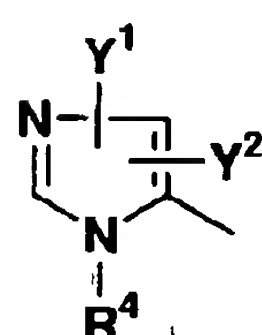
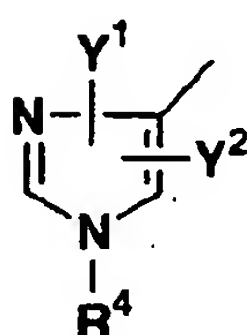
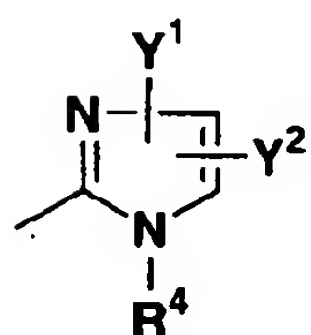
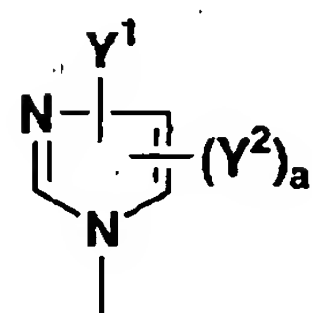
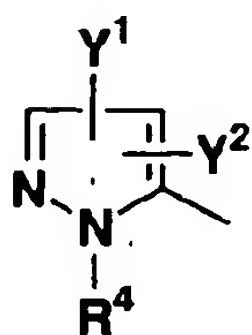
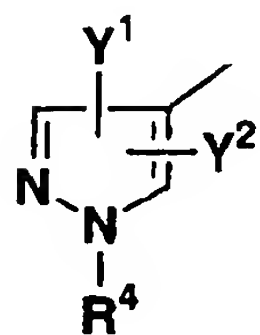
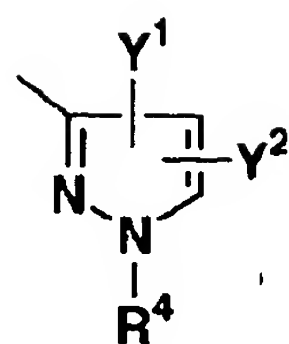
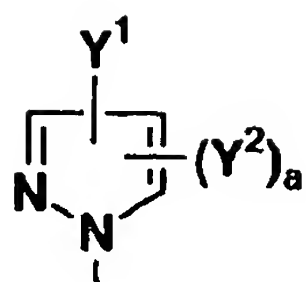
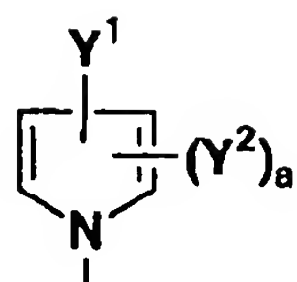
【化16】



【0024】(式中、R⁶およびR⁷はそれぞれ独立に水素原子またはC₁~C₄アルキル基を表し、Q¹は

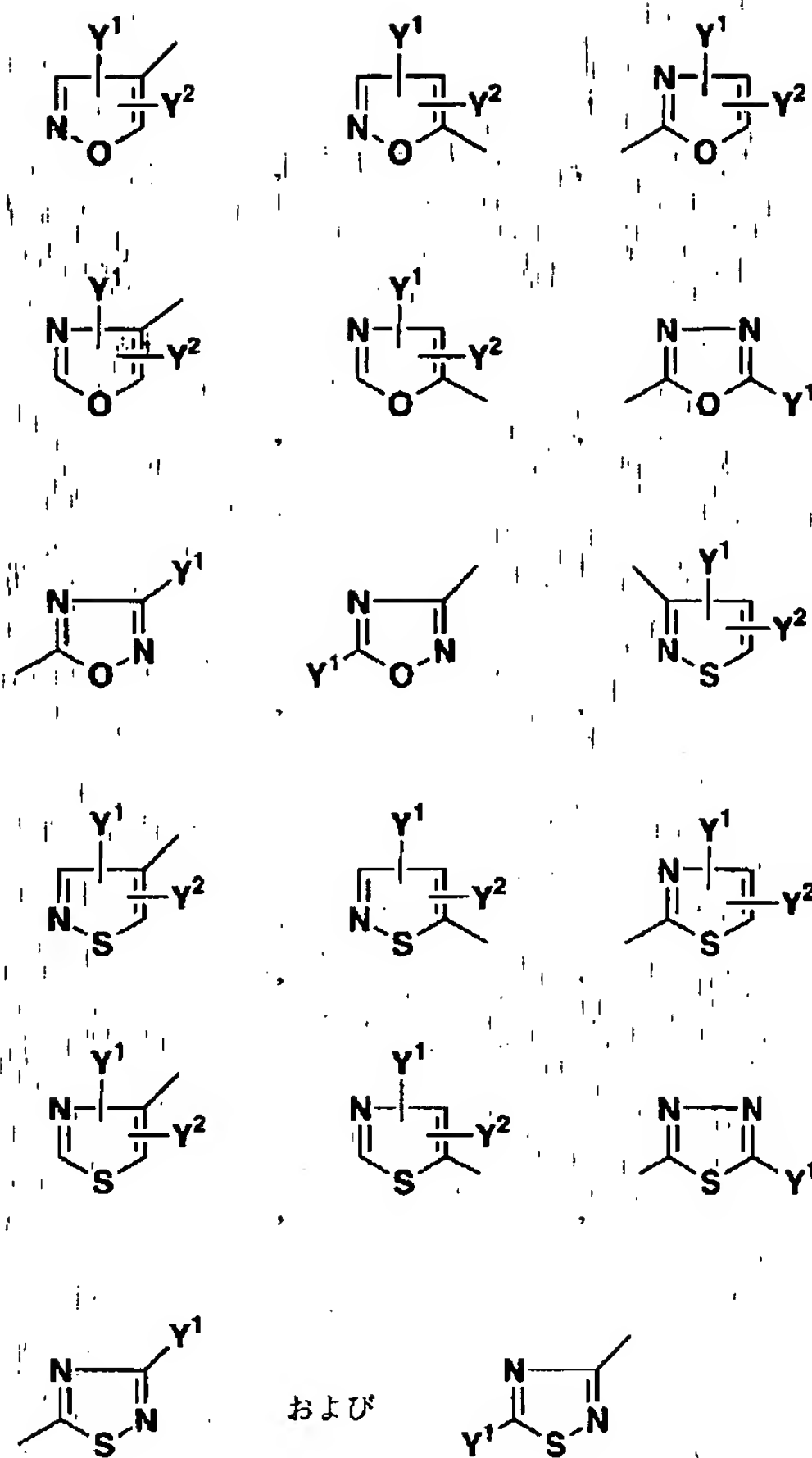
【0025】

【化17】



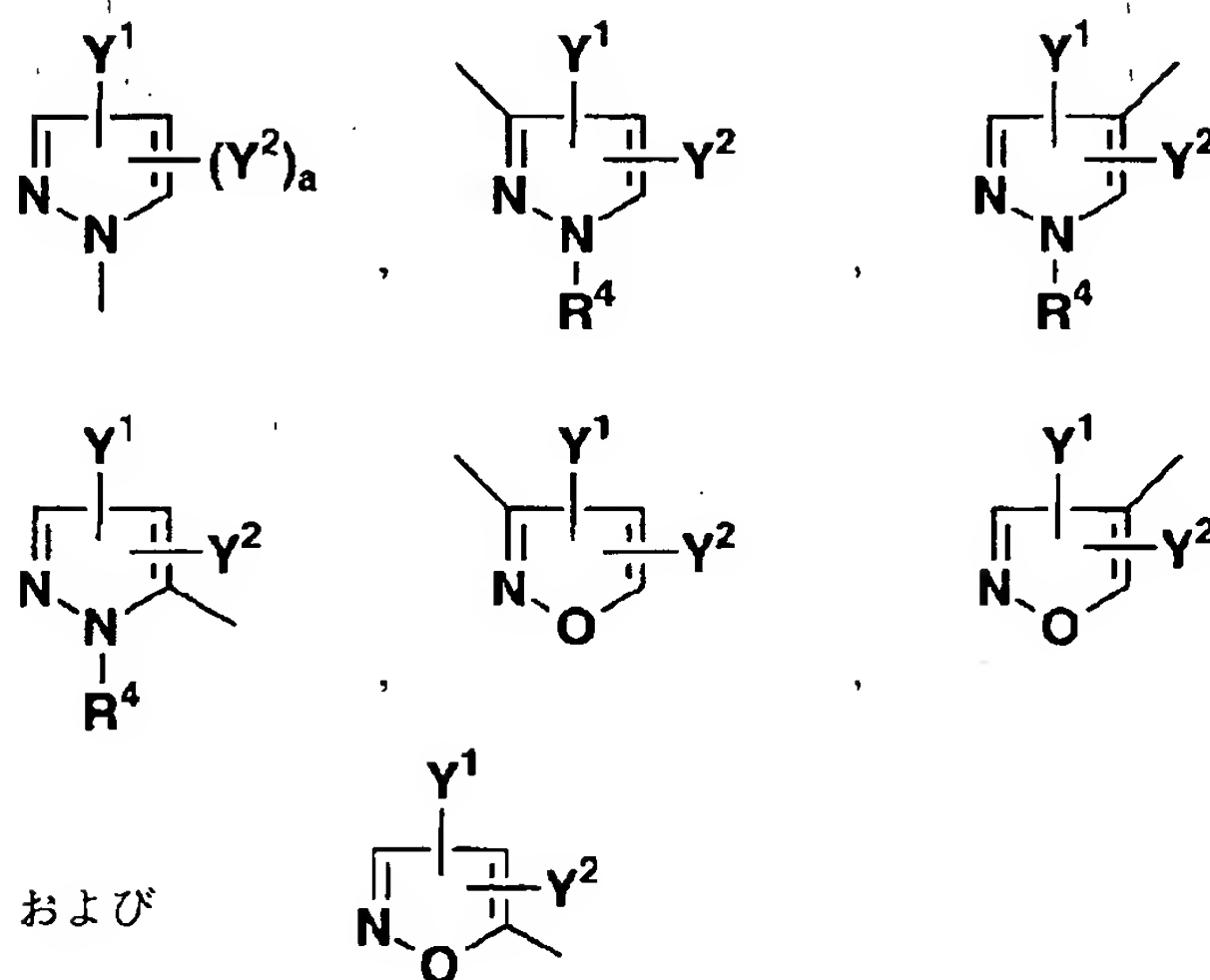
【0026】

【化18】



【0027】を表し、 Q^2 は
【0028】

【化19】



【0029】を表し、 R^4 は水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基を表し、 Y^1 は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、($C_1 \sim C_4$ アルコキシ)カルボニル基またはカル

ボキシ基を表し、 Y^2 は水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル基、 $C_1 \sim$

C₄アルキルスルホニル基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル基、ニトロ基、シアノ基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基またはカルボキシ基を表し、aは1または2を表し、aが2を表す場合、Y²は同一でも異なってもよい。)があげられる。

【0030】次に具体的な置換基をあげる。R¹としては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、iso-プロピル基、n-ブチル基、iso-ブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、2-クロロエチル基、2-ブロモエチル基、2, 3-ジクロロプロピル基、3-クロロプロピル基、1, 2-ジクロロ-1-メチルエチル基、4-クロロブチル基、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、iso-プロポキシ基、n-ブトキシ基、iso-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、2-ブロモエトキシ基、3-フルオロプロポキシ基、3-クロロプロポキシ基、4-クロロブトキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、iso-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、iso-ブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、n-プロポキシメチル基、iso-プロポキシメチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、2-n-プロポキシエチル基、2-iso-プロポキシエチル基、1-メトキシエチル基、1-エトキシエチル基、1-n-プロポキシエチル基、1-iso-プロポキシエチル基、3-メトキシプロピル基、3-エトキシプロピル基、メチルチオメチル基、エチルチオメチル基、n-プロピルチオメチル基、iso-プロピルチオメチル基、2-メチルチオエチル基、2-エチルチオエチル基、2-n-プロピルチオエチル基、2-iso-プロピルチオエチル基、1-メチルチオエチル基、1-エチルチオエチル基、1-n-プロピルチオエチル基、1-iso-プロピルチオエチル基、3-メチルチオプロピル基、3-エチルチオプロピル基、アセチル基、弗素原子、塩素原子、臭素原子および沃素原子があげられる。

【0031】R²としては、水素原子、メチル基、エチル基、n-プロピル基、iso-プロピル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、iso-プロポキシ基、トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、沃素原子、ニトロ基およびシアノ基があげられる。

【0032】R³としては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、iso-プロピル基、n-ブチル基、iso-ブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル

基、n-ペンチル基、iso-ペンチル基、2-メチルブチル基、sec-ペンチル基、tert-ペンチル基、1, 2-ジメチルプロピル基、2, 2-ジメチルプロピル基、1-エチルプロピル基、n-ヘキシル基、1-メチルペンチル基、2-メチルペンチル基、4-メチルペンチル基、1, 1-ジメチルブチル基、1-エチルブチル基、2-エチルブチル基、n-ヘプチル基、1-エチルペンチル基、1-n-プロピルブチル基、シクロプロピル基、1-メチルシクロプロピル基、2-メチルシクロプロピル基、1, 2-ジメチルシクロプロピル基、2, 2-ジメチルシクロプロピル基、2, 3-ジメチルシクロプロピル基、2, 2, 3, 3-テトラメチルシクロプロピル基、シクロブチル基、2-メチルシクロブチル基、3-メチルシクロブチル基、シクロペンチル基、2-メチルシクロペンチル基、3-メチルシクロペンチル基、シクロヘキシル基、1-メチルシクロヘキシル基、2-メチルシクロヘキシル基、シクロヘプチル基、ビニル基、1-メチルビニル基、1-プロペニル基、アリル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-メチル-1-プロペニル基、1-メチル-2-プロペニル基、1-エチルビニル基、2-メチル-1-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、1-メチル-1-ブテニル基、1-メチル-3-ブテニル基、3-メチル-1-ブテニル基、1, 1-ジメチル-2-プロペニル基、1, 2-ジメチル-1-プロペニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、5-ヘキセニル基、1-メチル-1-ペンテニル基、1, 3-ジメチル-1-ブテニル基、1-シクロペンテニル基、1-シクロヘキセニル基、3-シクロヘキセニル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、n-プロポキシメチル基、iso-プロポキシメチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、2-n-プロポキシエチル基、2-iso-プロポキシエチル基、1-メトキシエチル基、1-メトキシプロピル基、1-エトキシプロピル基、1-エトキシエチル基、2-メトキシ-1-メチルエチル基、2-エトキシ-1-メチルエチル基、1-メトキシメチルプロピル基、1-エトキシメチルプロピル基、メチルチオメチル基、エチルチオメチル基、n-プロピルチオメチル基、iso-プロピルチオメチル基、2-メチルチオエチル基、2-エチルチオエチル基、1-メチルチオプロピル基、1-エチルチオプロピル基、2-n-プロピルチオエチル基、2-iso-プロピルチオエチル基、1-メチルチオエチル基、1-エチルチオエチル基、2-メチルチオ-1-メチルエチル基、2-エチルチオ-1-メチルエチル基、1-メチルチオメチルプロピル基、1-エチルチオメチルプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、1

1-シクロプロピルエチル基、2-シクロプロピルエチル基、フルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ヨードメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、クロロフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、トリクロロメチル基、トリブロモメチル基、トリフルオロメチル基、1-フルオロエチル基、2-フルオロエチル基、1-クロロエチル基、2-クロロエチル基、1-ブロモエチル基、2-ブロモエチル基、1-ヨードエチル基、2-ヨードエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2, 2, 2-トリクロロエチル基、2, 2-ジクロロ-1-フルオロエチル基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、1, 1-ジクロロエチル基、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル基、1, 2-ジクロロエチル基、2-クロロ-1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル基、1, 2-ジブロモエチル基、ペンタクロロエチル基、1-クロロ-1-メチルエチル基、1-ブロモ-1-メチルエチル基、1, 2-ジクロロ-1-メチルエチル基、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル基、1-ブロモ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル基、1, 2-ジブロモ-1-メチルエチル基、1-クロロプロピル基、1-ブロモプロピル基、ビス(トリフルオロメチル)メチル基、1, 2-ジクロロプロピル基、2, 3-ジクロロプロピル基、1-クロロブチル基、1-ブロモブチル基、ヘプタフルオロプロピル基、1-クロロ-2-メチルプロピル基、1-ブロモ-2-メチルプロピル基、1, 1-ビス(クロロメチル)エチル基、2-クロロ-1, 1-ジメチルエチル基、2, 2-ジクロロ-1, 1-ジメチルエチル基、ノナフルオロブチル基、2, 3-ジクロロ-1-メチルプロピル基、1-クロロシクロプロピル基、2-クロロシクロプロピル基、2, 2-ジクロロシクロプロピル基、2, 2-ジメチルシクロプロピル基、2, 2-ジクロロ-1-メチルシクロプロピル基、2, 2-ジクロロ-3, 3-ジメチルシクロプロピル基、1-クロロシクロヘキシル基、1-クロロビニル基、1-ブロモビニル基、2-クロロビニル基、2-ブロモビニル基、2, 2-ジブロモビニル基、1-ブロモメチルビニル基、2-クロロ-1-メチルビニル基、2-ブロモ-1-メチルビニル基、1-クロロ-1-プロペニル基、1-ブロモ-1-プロペニル基、2-プロモ-1-プロペニル基、2, 3, 3, 3-テトラクロロ-1-プロペニル基、3-クロロ-2-メチル-1-プロペニル基、1, 2, 3, 3, 4, 4, 4-ヘプタフルオロ-1-プロペニル基、2-トリフルオロメチル-1-プロペニル基、1-トリフルオロメチルビニル基、1-クロロメチルビニル基、1, 2-ジクロロビニル基、2, 2-ジクロロビニル基、1, 2, 2-トリクロロビニル基、2-クロロ-1-プロペニル基、3, 3, 3-トリフルオロ-2-トリフルオロメチル-

1-プロペニル基、2, 3-ジクロロ-2-プロペニル基、エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-クロロエチニル基、2-ブロモエチニル基、2-ヨードエチニル基および

【0033】

【化20】



【0034】があげられ、Zとしては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、iso-プロピル基、n-ブチル基、iso-ブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、沃素原子、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、iso-プロポキシ基、n-ブトキシ基、iso-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロエチル基、3-クロロプロピル基、クロロメチル基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、クロロジフルオロメトキシ基、ブロモジフルオロメトキシ基、2-クロロエトキシ基、3-クロロプロポキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、iso-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、iso-ブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、n-プロピルスルフィニル基、iso-プロピルスルフィニル基、n-ブチルスルフィニル基、iso-ブチルスルフィニル基、sec-ブチルスルフィニル基、tert-ブチルスルフィニル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、n-プロピルスルホニル基、iso-プロピルスルホニル基、n-ブチルスルホニル基、iso-ブチルスルホニル基、sec-ブチルスルホニル基、tert-ブチルスルホニル基、ジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、クロロジフルオロメチルチオ基、ブロモジフルオロメチルチオ基、ジフルオロメチルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、クロロジフルオロメチルスルフィニル基、ブロモジフルオロメチルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基、クロロジフルオロメチルスルホニル基、ブロモジフルオロメチルスルホニル基、ニトロ基、シアノ基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、iso-プロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、iso-ブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基およびtert-ブトキシカルボニル基等があげられる。

【0035】Aとしては水素原子、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、n-プロピルカルボニル基、i

s o - プロピルカルボニル基、n - ブチルカルボニル
 基、i s o - ブチルカルボニル基、s e c - ブチルカル
 ボニル基、t e r t - ブチルカルボニル基、フルオロア
 セチル基、クロロアセチル基、ブロモアセチル基、ヨ
 ドアセチル基、ジフルオロアセチル基、クロロフルオ
 ロアセチル基、ジクロロアセチル基、ジブロモアセチル
 基、トリフルオロアセチル基、クロロジフルオロアセチ
 ル基、ブロモジフルオロアセチル基、トリクロロアセチ
 ル基、トリブロモアセチル基、2 - クロロプロピオニ
 ル基、2 - フルオロプロピオニル基、2 - ブロモプロピ
 オニル基、2 - ヨードプロピオニル基、3 - フルオロプロ
 ピオニル基、3 - クロロプロピオニル基、3 - ブロモプロ
 ピオニル基、3 - ヨードプロピオニル基、2, 3 - ジ
 クロロプロピオニル基、2, 3 - ジブロモプロピオニル
 基、2, 3 - ジフルオロプロピオニル基、2, 2 - ジク
 ロロプロピオニル基、2 - フルオロ - 3, 3 - ジクロ
 ロプロピオニル基、3, 3, 3 - トリフルオロプロピ
 オニル基、3, 3, 3 - トリクロロプロピオニル基、2,
 2, 3, 3 - テトラフルオロプロピオニル基、2, 2,
 3, 3 - テトラフルオロ - 3 - クロロプロピオニル基、
 ペンタフルオロプロピオニル基、ペンタクロロプロピ
 オニル基、2, 3, 3, 3 - テトラフルオロプロピオニ
 ル基、2 - クロロ - 2, 3, 3, 3 - テトラフルオロプロ
 ピオニル基、2 - ブロモ - 2, 3, 3, 3 - テトラフル
 オロプロピオニル基、2 - フルオロ - 2 - メチルプロ
 ピオニル基、2 - クロロ - 2 - メチルプロピオニル基、2
 - ブロモ - 2 - メチルプロピオニル基、2, 3 - ジクロ
 ロ - 2 - メチルプロピオニル基、2, 3 - ジブロモ - 2
 - メチルプロピオニル基、3, 3, 3 - トリフルオロ -
 2 - トリフルオロメチルプロピオニル基、2 - メチル -
 3, 3, 3 - トリフルオロプロピオニル基、1 - クロロ
 プロピルカルボニル基、1 - フルオロプロピルカルボ
 ニル基、1 - ブロモプロピルカルボニル基、2, 3 - ジク
 ロロプロピルカルボニル基、1, 2 - ジクロロプロピ
 ルカルボニル基、3 - クロロ - 2 - メチルプロピオニ
 ル基、3 - ブロモ - 2 - メチルプロピオニル基、2 - ク
 ロメチル - 3 - クロロプロピオニル基、1, 1, 2,
 2, 3, 3, 3 - ヘプタフルオロプロピルカルボニ
 ル基、1 - クロロブチルカルボニル基、1 - ブロモブチ
 ルカルボニル基、1 - クロロ - 2 - メチルプロピルカル
 ボニル基、1 - ブロモ - 2 - メチルプロピルカルボ
 ニル基、2, 2 - ビス (クロロメチル) プロピオニル基、3
 - クロロ - 2, 2 - ジメチルプロピオニル基、3, 3 -
 ジクロロ - 2, 2 - ジメチルプロピオニル基、2, 3 -
 ジクロロ - 1 - メチルプロピルカルボニル基、1, 1,
 2, 2, 3, 3, 4, 4, 4 - ノナフルオロブチルカル
 ボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボ
 ニル基、n - プロポキシカルボニル基、i s o - プロ
 ポキシカルボニル基、n - ブトキシカルボニル基、i s o -
 ブトキシカルボニル基、s e c - ブトキシカルボニル基、

t e r t - ブトキシカルボニル基、2 - フルオロエトキ
 シカルボニル基、2 - クロロエトキシカルボニル基、2
 - ブロモエトキシカルボニル基、2, 2, 2 - トリフル
 オロエトキシカルボニル基、3 - クロロプロポキシ基、
 ビス (トリフルオロメチル) メトキシカルボニル基、4
 - クロロブトキシカルボニル基、アクリロイル基、メタ
 クリロイル基、クロトノイル基、2 - プロペニルカル
 ボニル基、1 - ブテニルカルボニル基、2 - ブテニルカル
 ボニル基、3 - ブテニルカルボニル基、1 - メチル - 1
 - プロペニルカルボニル基、1 - メチル - 2 - プロペ
 ニルカルボニル基、2 - メチル - 1 - プロペニルカルボ
 ニル基、2 - メチル - 2 - プロペニルカルボニル基、2 -
 エチルアクリロイル基、メチルチオカルボニル基、エチ
 ルチオカルボニル基、n - プロピルチオカルボニル基、
 i s o - プロピルチオカルボニル基、n - ブチルチオカ
 ルボニル基、i s o - ブチルチオカルボニル基、s e c
 - ブチルチオカルボニル基、t e r t - ブチルチオカル
 ボニル基、シクロプロピルカルボニル基、1 - メチルシ
 クロプロピルカルボニル基、2 - メチルシクロプロピ
 ルカルボニル基、2, 2 - ジメチルシクロプロピルカル
 ボニル基、シクロブチルカルボニル基、シクロペンチ
 ルカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロ
 プロピルオキシカルボニル基、1 - メチルシクロプロ
 ピルオキシカルボニル基、2 - メチルシクロプロピル
 オキシカルボニル基、2, 2 - ジメチルシクロプロピ
 ルオキシカルボニル基、シクロブチルオキシカルボ
 ニル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、シクロ
 ヘキシルオキシカルボニル基、メチルチオ基、エチ
 ルチオ基、n - プロピ
 ルチオ基、i s o - プロピルチオ基、n - ブチルチ
 オ基、i s o - ブチルチオ基、s e c - ブチルチオ基、
 t e r t - ブチルチオ基、トリクロロメチルチオ基、トリ
 フルオロメチルチオ基、クロロジフルオロメチルチ
 オ基、ジクロロフルオロメチルチオ基、ペンタフル
 オロエチルチオ基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘプ
 タフルオロプロピルチオ基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4,
 4, 4 - ノナフルオロブチルチオ基、メチルスルフィ
 ニル基、エチルスルフィニル基、n - プロピルスルフィ
 ニル基、i s o - プロピルスルフィニル基、n - ブチル
 スルフィニル基、i s o - ブチルスルフィニル基、s e c
 - ブチルスルフィニル基、t e r t - ブチルスルフィ
 ニル基、トリクロロメチルスルフィニル基、トリフル
 オロメチルスルフィニル基、クロロジフルオロメチ
 ルスルフィニル基、ジクロロフルオロメチルスルフィ
 ニル基、ペンタフルオロエチルスルフィニル基、1, 1,
 2, 2, 3, 3, 3 - ヘプタフルオロプロピルスルフィ
 ニル基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4, 4 - ノナフル
 オロブチルスルフィニル基、メチルスルホニル基、
 エチルスルホニル基、n - プロピルスルホニル基、
 i s o - プロピルスルホニル基、n - ブチルスルホ
 ニル基、i s o - ブチルスルホニル基、s e c - ブチ
 ルスルホニル基、t e

ル基、トリフルオロメチルスルホニル基、クロロシフル
オロメチルスルホニル基、ジクロロフルオロメチルスル
ホニル基、ペンタフルオロエチルスルホニル基、1,
1, 2, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロピルスル
ホニル基および1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-
ノナフルオロブチルスルホニル基等があげられる。

【0036】Qとしては

【0037】

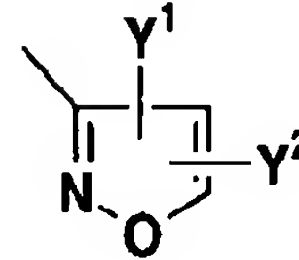
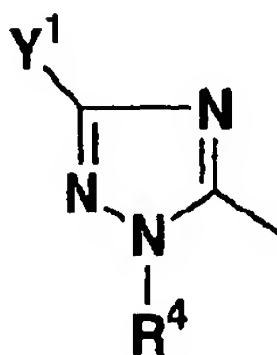
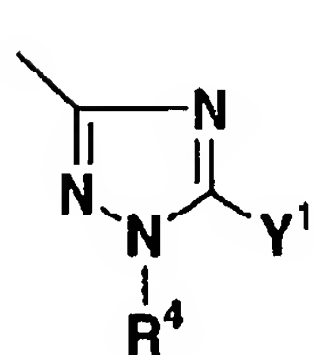
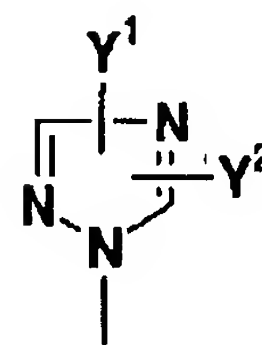
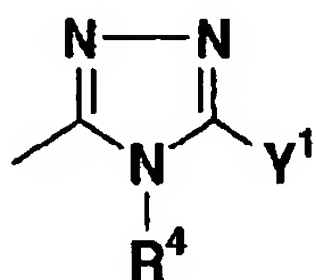
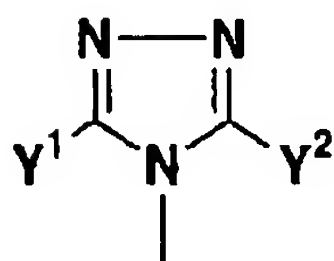
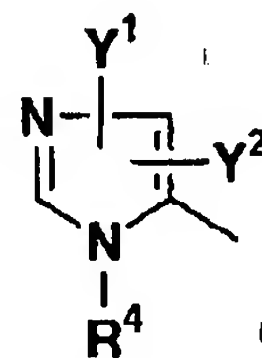
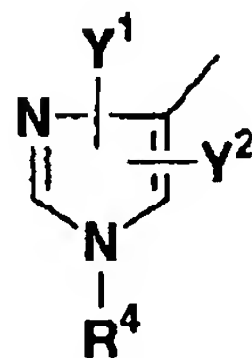
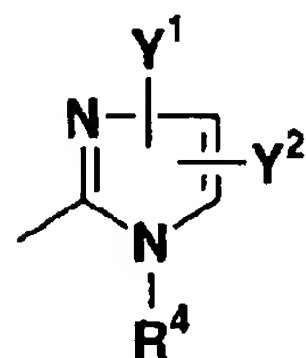
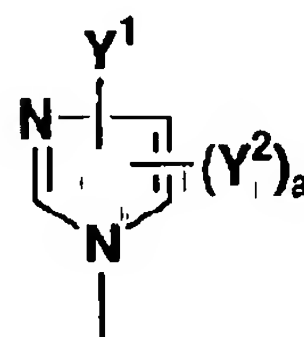
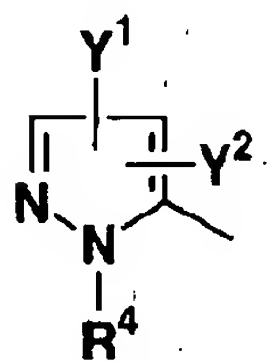
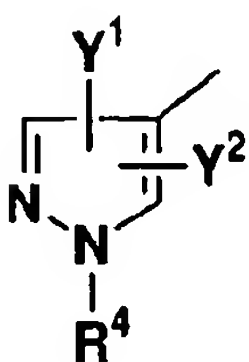
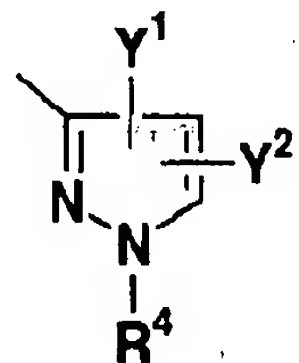
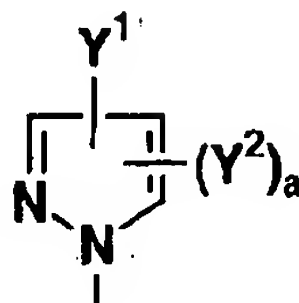
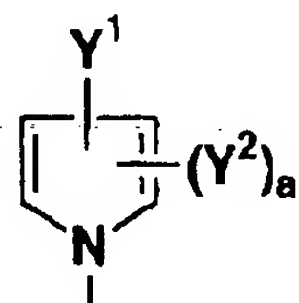
【化21】

および Q
R⁶ R⁷

【0038】があげられ、R⁶、R⁷としてはそれぞれ独
立に水素原子、メチル基、エチル基、n-プロピル基、
iso-プロピル基、n-ブチル基、iso-ブチル
基、sec-ブチル基およびtert-ブチル基があげ
られ、Q¹としては、

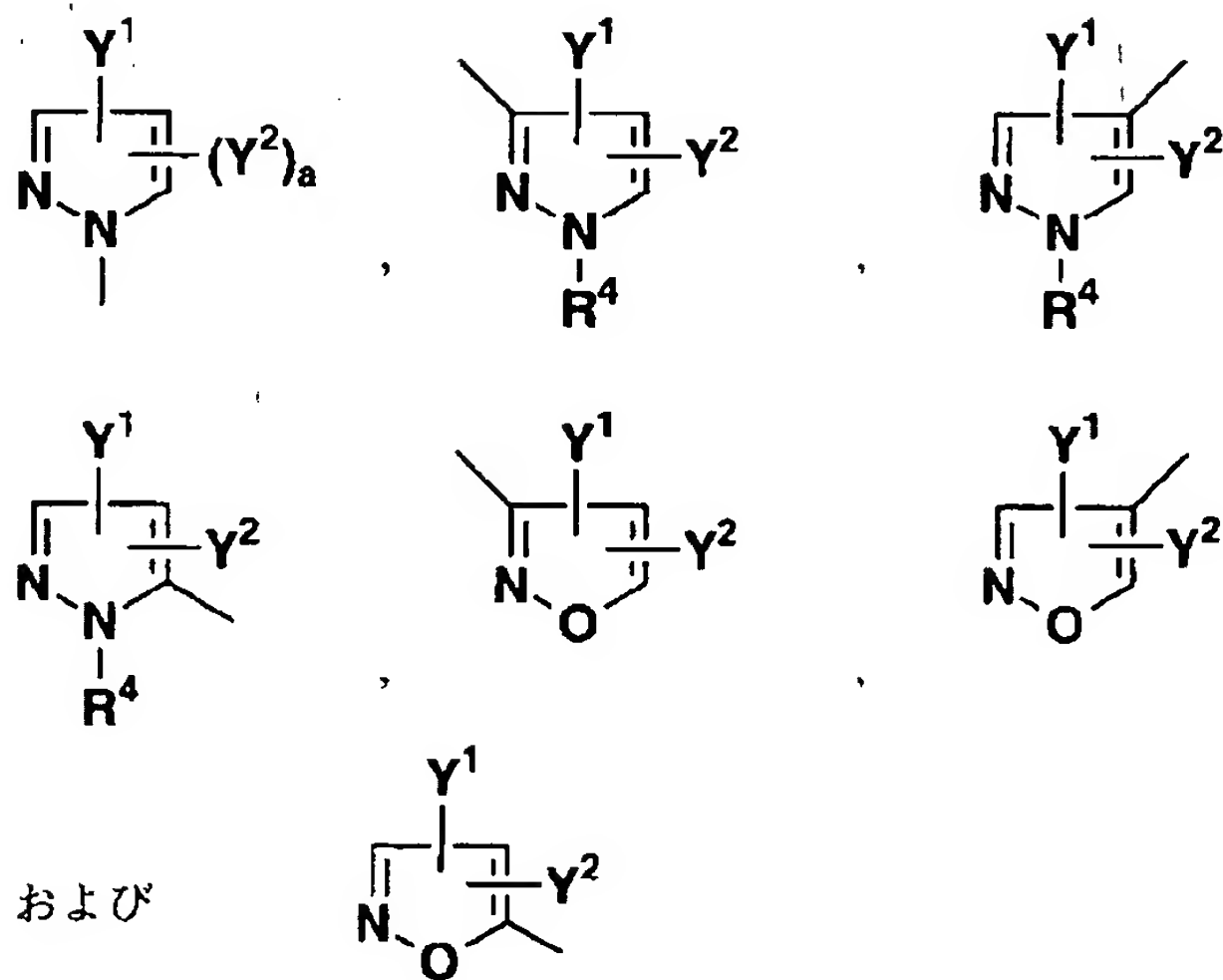
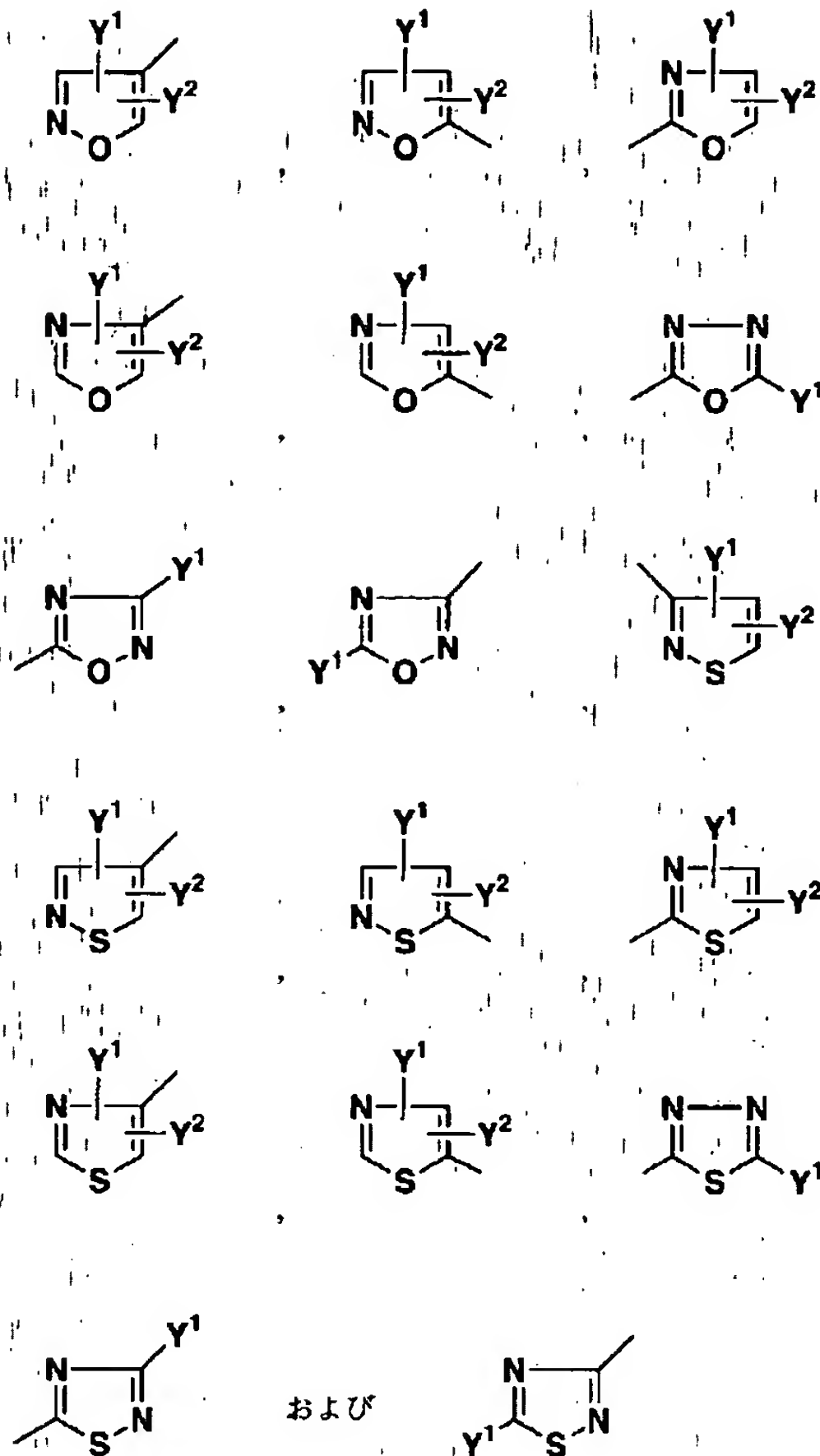
【0039】

【化22】



【0040】

【化23】



基、クロロジフルオロメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、沃素原子、ニトロ基、シアノ基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカ

基、クロロジフルオロメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、沃素原子、ニトロ基、シアノ基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカ

ルボニル基、*n*-プロポキシカルボニル基、*iso*-プロポキシカルボニル基、*n*-ブトキシカルボニル基、*iso*-ブトキシカルボニル基、*sec*-ブトキシカルボニル基および *tert*-ブトキシカルボニル基があげられ、 Y^2 としては、水素原子、弗素原子、塩素原子、臭素原子、沃素原子、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*iso*-プロピル基、*n*-ブチル基、*iso*-ブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロエチル基、2-ブロモエチル基、3-クロロプロピル基、2, 3-ジクロロプロピル基、メトキシ基、エトキシ基、*n*-プロポキシ基、*iso*-プロポキシ基、*n*-ブトキシ基、*iso*-ブトキシ基、*sec*-ブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、*n*-プロピルチオ基、*iso*-プロピルチオ基、*n*-ブチルチオ基、*iso*-ブチルチオ基、*sec*-ブチルチオ基、*tert*-ブチルチオ基、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、*n*-プロピルスルフィニル基、*iso*-プロピルスルフィニル基、*n*-ブチルスルフィニル基、*iso*-ブチルスルフィニル基、*sec*-ブチルスルフィニル基、*tert*-ブチルスルフィニル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、*n*-プロピルスルホニル基、*iso*-プロピルスルホニル基、*n*-ブチルスルホニル基、*iso*-ブチルスルホニル基、*sec*-ブチルスルホニル基、*tert*-ブチルスルホニル基、ジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、クロロジフルオロメチルチオ基、ブロモジフルオロメチルチオ基、ジフルオロメチルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、クロロジフルオロメチルスルフィニル基、ブロモジフルオロメチルスルフィニル基、ジフルオロメチルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基、クロロジフルオロメチルスルホニル基、ブロモジフルオロメチルスルホニル基、ニトロ基、シアノ基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、*n*-プロポキシカルボニル基、*iso*-プロポキシカルボニル基、*n*-ブトキシカルボニル基、*iso*-ブトキシカルボニル基、*sec*-ブトキシ

カルボニル基および *tert*-ブトキシカルボニル基等があげられ、 R^4 としては、水素原子、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*iso*-プロピル基、*n*-ブチル基、*iso*-ブチル基、*sec*-ブチル基および *tert*-ブチル基があげられる。

【0044】 X としては、酸素原子、硫黄原子、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、*n*-プロピルアミノ基、*iso*-プロピルアミノ基および単結合があげられる。本発明化合物は、畑地、水田、非耕地用除草剤として、土壌処理、土壌混和处理、茎葉処理のいずれの処理方法においても使用できる。

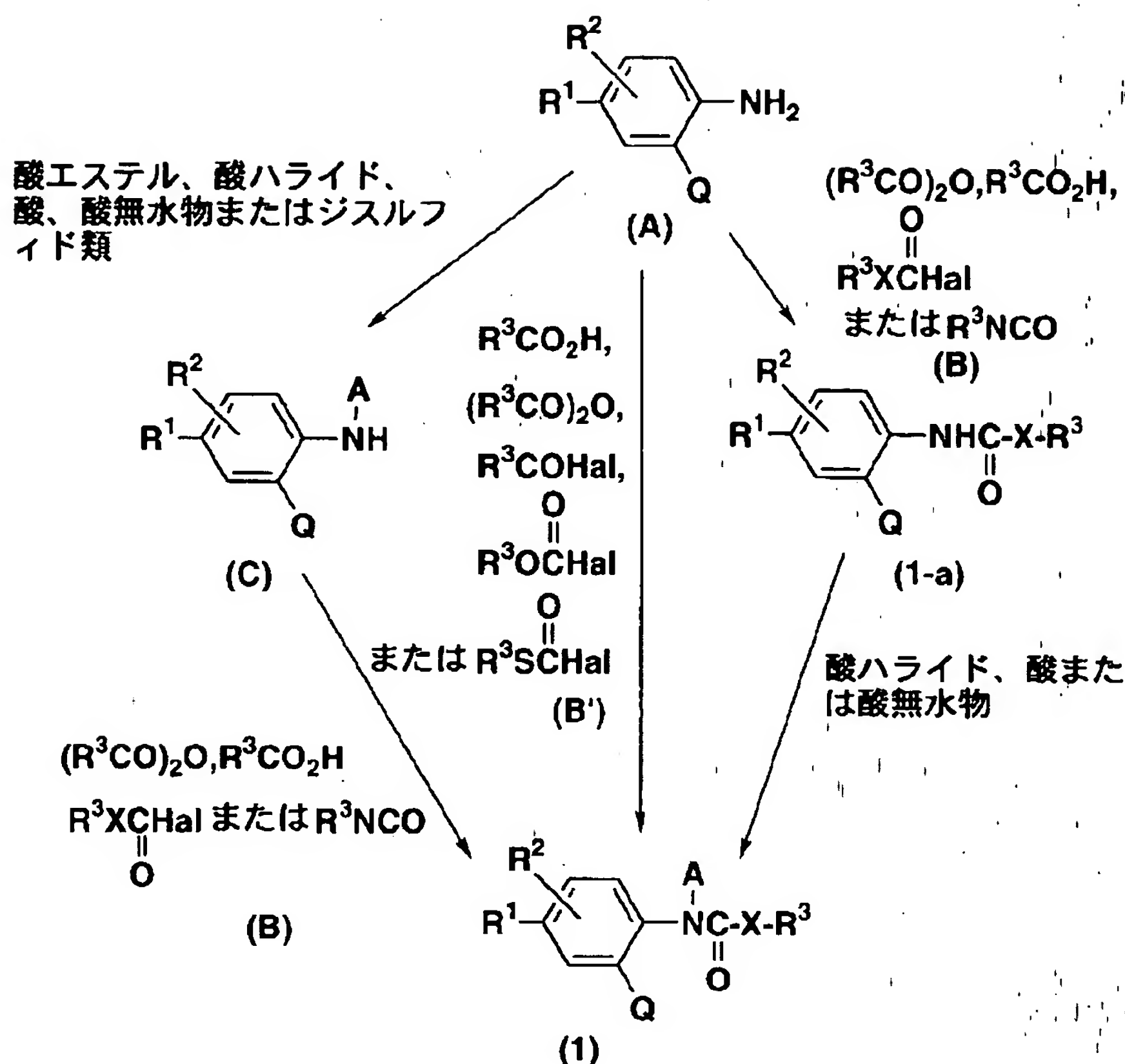
【0045】本発明化合物を含有する除草剤の対象雑草としては、イヌホウズキ、チョウセンアサガオ、イチビ、アメリカキンゴジカ、アルバアサガオ、イヌビユ、アオビユ、オナモミ、ブタクサ、ヒマワリ、ハキダメギク、セイヨウトゲアザミ、ノボロギク、ヒメジョオン、イヌガラシ、ノハラガラシ、ナズナ、イヌタデ、ツバカズラ、スベリヒユ、シロザ、コアカザ、ホウキギ、ハコベ、オオイヌノフグリ、ツユクサ、ホトケノザ、ヒメオドリコソウ、コニシキソウ、オオニシキソウ、ヤエムグラ、アカネ、スミレ、アメリカツノクサネム、エビスグサ、コセンダングサ等の広葉雑草、野生ソルガム、オオクサキビ、ジョンソングラス、イヌビユ、メビシバ、カラスムギ、オヒシバ、エノコログサ、スズメノテッポウ等のイネ科雑草、ハマスゲ等のカヤツリグサ科雑草、ヘラオモダカ、オモダカ、ウリカワ、タマガヤツリ、ミズガヤツリ、ホタルイ、クログワイ、アゼナ、コナギ、ヒルムシロ、キカングサ、タイヌビエ等の各種水田雑草があげられる。

【0046】本発明化合物を含有する除草剤の対象作物としては、重要作物であるコムギ、オオムギ、トウモロコシ、ダイズ、イネ、ワタ、ビート、ソルガム等があげられる。また、本発明化合物を含有する除草剤は、落葉剤(defoliant)としても有用である。

【0047】本発明化合物は、例えば次に示す方法(スキーム1)によって合成することができる。(スキーム1の Q 、 A 、 R^1 、 R^2 、 R^3 および X は前記と同様の意味を表し、 Hal はハロゲン原子を表す。)

【0048】

【化25】



スキーム1

【0049】スキーム1はアニリン誘導体(A)を出発原料として3種の合成ルートを示している。一つはアニリン誘導体(A)に酸、酸無水物、酸ハライドまたは酸エステルなど(B)を反応させ本発明化合物(1-a)を合成し、さらにカルボン酸、スルフェン酸、スルフィン酸またはスルホン酸もしくは、これら酸の酸ハロゲン化物や酸無水物を反応させ、本発明化合物(1)を合成する方法を表す。

【0050】もう一つは、アニリン誘導体(A)に酸エステル、酸、酸無水物、酸ハライドまたはジスルフィド類を反応させ化合物(C)を合成し、さらに酸、酸無水物、酸ハライドまたは酸エステルなど(B)を反応させ本発明化合物(1)を合成する方法を表す。最後の一つは、アニリン誘導体(A)に酸、酸無水物、酸ハライドなど(B')を反応させ本発明化合物(1)を直接一段階で合成する方法を表す。

【0051】本発明化合物を精製する必要がある場合

には、再結晶、カラムクロマトグラフィー等の任意の精製法によって分離、精製することができる。なお、本発明に包含される化合物の中で不斉炭素を有する場合には、光学活性な化合物(+)体および(-)体が含まれる。幾何異性体が存在する場合には、シス体およびトランス体が含まれる。

【0052】以下に本発明化合物の合成例を実施例として具体的に述べるが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

【0053】

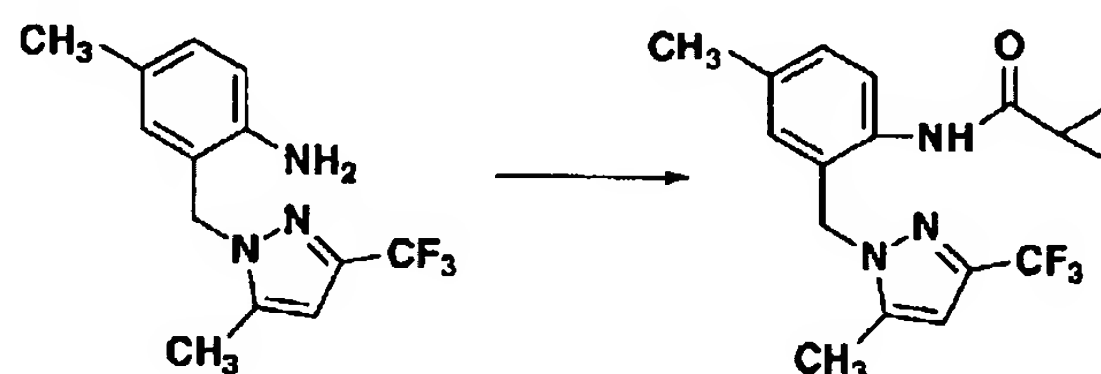
【実施例】

【実施例1】

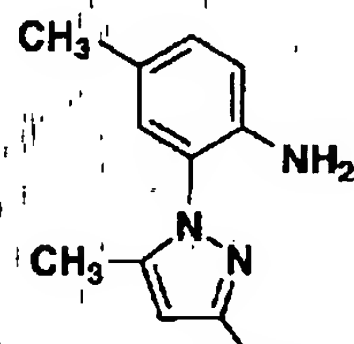
1-(2-シクロプロパンカルボニルアミノ-5-メチルフェニルメチル)-5-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール(化合物No.C-4)の合成

【0054】

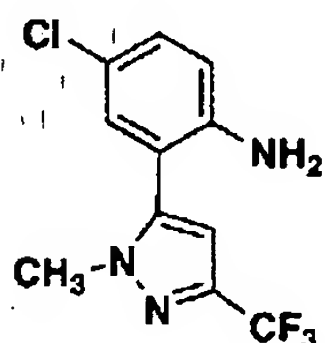
【化26】



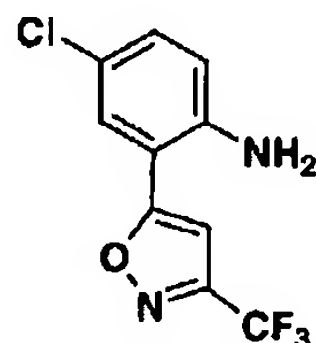
【0055】 1-(2-アミノ-5-メチルフェニル)-5-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール0.52g(1.93mmol)のピリジン5ml溶液中に、氷冷下、シクロプロパンカルボニルクロライド0.2ml(2.20mmol)をゆっくりと滴下した。滴下終了後、その反応液を氷冷下で1時間攪拌した。反応が終了したことを確認した後、そのピリジン溶液を水中にゆっくりと加えた。析出してきた結晶を濾取し、水、次いでヘキサンで十分に洗浄したところ、目的とする1-(2-シクロプロパンカルボ



【0058】 1-(2-アミノ-5-メチルフェニル)-5-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール0.33g(1.29mmol)のピリジン4ml溶液中に、氷冷下、シクロプロパンカルボニルクロライド0.13ml(1.43mmol)をゆっくりと滴下した。滴下終了後、その反応液を氷冷下で1時間攪拌した。反応が終了したことを確認した後、そのピリジン溶液を水中にゆっくりと加えた。そして、酢酸エチルで抽出した後、その酢酸エチル層を順次、十分に、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水、希塩酸、水そして飽和食塩水で洗浄した。酢酸エチル抽出液を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下で留去したところ、粘性液体が得られた。その粘性液体にヘキサンを加え結



【0061】 5-(2-アミノ-5-クロロフェニル)-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール0.15g(0.55mmol)およびピリジン0.06g(0.76mmol)のTHF 2ml溶液中に、氷冷下、シクロプロパンカルボニルクロライド0.05ml(0.55mmol)を滴下した。滴下終了後、その反応液を室温で1.5時間攪拌した。反応が終了したことを確認した後、その反応液を水中に加えた。析出してきた結晶を濾取し、水、次いでヘキサンで十分に洗浄したところ、目的とする5-(5-クロロ-2-シクロプロ



【0064】 5-(2-アミノ-5-クロロフェニル)-3-トリフルオロメチルイソオキサゾール0.09g(0.34

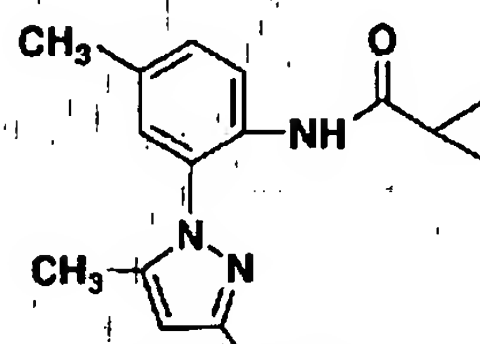
ニルアミノ-5-メチルフェニルメチル)-5-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾールが白色結晶として0.58g(収率=89%)得られた。

【0056】 [実施例2]

1-(2-シクロプロパンカルボニルアミノ-5-メチルフェニル)-5-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール(化合物No. C-16)の合成

【0057】

【化27】



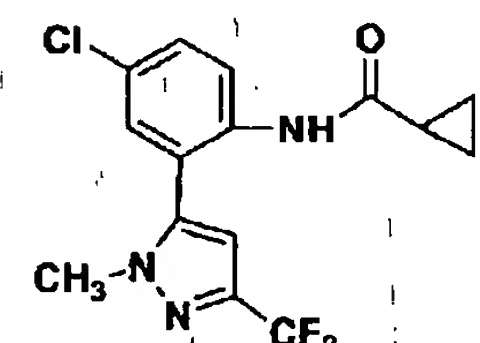
晶化させ、その結晶を十分にヘキサンで洗浄したところ、目的とする1-(2-シクロプロパンカルボニルアミノ-5-メチルフェニル)-5-メチル-3-トリフルオロピラゾールが白色結晶として0.3g(収率=72%)得られた。

【0059】 [実施例3]

5-(5-クロロ-2-シクロプロパンカルボニルアミノフェニル)-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール(化合物No. C-20)の合成

【0060】

【化28】



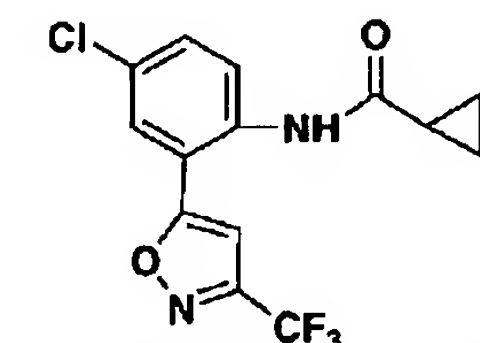
パンカルボニルアミノフェニル)-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾールが結晶として0.18g(収率=96%)得られた。

【0062】 [実施例4]

5-(5-クロロ-2-シクロプロパンカルボニルアミノフェニル)-3-トリフルオロメチルイソオキサゾール(化合物No. C-27)の合成

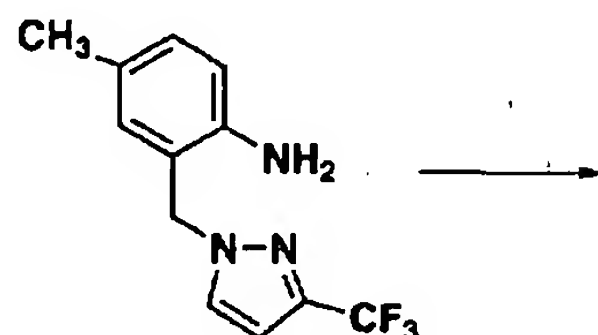
【0063】

【化29】



mmol)およびピリジン0.04g(0.51mmol)のTHF 2ml溶液中に、氷冷下、シクロプロパンカルボニルクロライド0.

04ml (0.34mmol)を滴下した。滴下終了後、その反応液を室温で1時間攪拌した。反応が終了したことを確認した後、その反応液を水中に加えた。析出してきた結晶を濾取し、水、次いでヘキサンで十分に洗浄したところ、目的とする5-(5-クロル-2-シクロプロパンカルボニルアミノフェニル)-3-トリフルオロイソキサゾールが結晶として0.11g (収率=97%) が得られた。



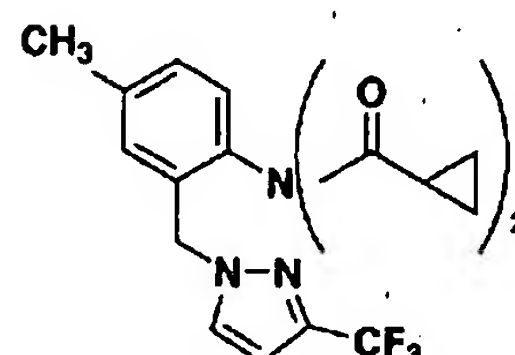
【0066】1-(2-アミノ-5-メチルフェニルメチル)-3-トリフルオロメチルピラゾール0.28g (1.09mmol) およびトリエチルアミン3.5mlのTHF 5ml溶液中に、氷冷下、シクロプロパンカルボニルクロライド0.44ml (4.85mmol)を滴下した。滴下終了後、その反応液を室温で30分間攪拌そして3時間還流した。反応が終了したことを確認した後、その溶液を水中にゆっくりと加えた。そして、酢酸エチルで抽出した後、その酢酸エチル層を順次、十分に、希塩酸、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水そして飽和食塩水で洗浄した。酢酸エチル抽出液を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧留去したところ、粘性液体が得られた。この粘性液体を分取液体クロマトグラフィーで精製したところ、目的とする1-[2-ビス(シクロプロパンカルボニル)イミノ-5-メチルフェ

【実施例5】

1-[2-ビス(シクロプロパンカルボニル)イミノ-5-メチルフェニルメチル]-3-トリフルオロメチルピラゾール(化合物No. D-1)の合成

【0065】

【化30】



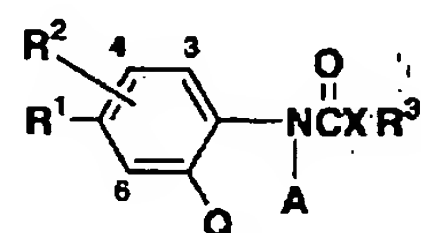
ニルメチル]-3-トリフルオロメチルピラゾールが白色結晶として0.33g (収率=76%) 得られた。

【0067】前記スキームあるいは実施例に準じて合成した本発明化合物を前記実施例で合成した化合物も含めて、構造式を表1-aと表1-bに、物性を表2-aと表2-bに示す。

【0068】【表1-a】

【0069】

【化31】



【0070】

【表1】

化合物No.	R ¹	R ²	X R ³	Q
(A=Hの場合)				
C-1	Me	—	c-Pro	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
C-2	Me	—	O-i-Pro	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
C-3	Me	—	CF ₃	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
C-4	Me	—	c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-5	Me	—	c-Pro	CH ₂ (3-Me-5-CF ₃ -Q-2)
C-6	Me	—	O-i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-7	Me	—	Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-8	Me	—	CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-9	Me	—	CH=CMe ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-10	Me	—	i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-11	Me	4-NO ₂	i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-12	Me	—	2,4-F ₂ -Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-13	Me	—	c-Pro	CH ₂ (3,5-(CF ₃) ₂ -Q-2)
C-14	Me	—	i-Pro	CH ₂ (3,5-(CF ₃) ₂ -Q-2)
C-15	Me	—	CF ₃	CH ₂ (3,5-(CF ₃) ₂ -Q-2)
C-16	Me	—	c-Pro	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
C-17	Me	—	i-Pro	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
C-18	Me	—	CF ₃	3-CF ₃ -5-Me-Q-2

【0071】

C-19	Me	—	i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -4-Cl-5-Me-Q-2)
C-20	Cl	—	c-Pro	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
C-21	Cl	—	-CH=CMe ₂	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
C-22	Cl	—	CF ₃	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)

【表2】

化合物No.	R ¹	R ²	X R ³	Q
C-23	Cl	—	2,4-F ₂ -Ph	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
C-24	Me	—	c-Pro	CH ₂ (3,5-Cl ₂ -4-CO ₂ Me-Q-2)
C-25	Cl	—	c-Pro	5-CF ₃ -Q-3(R ⁴ :Me)
C-26	Cl	—	c-Pro	5-CF ₃ -Q-15
C-27	Cl	—	c-Pro	3-CF ₃ -Q-17
C-28	Cl	—	CF ₃	5-CF ₃ -Q-15
C-29	Cl	—	2,4-F ₂ -Ph	5-CF ₃ -Q-15
C-30	Cl	—	-CH=CMe ₂	5-CF ₃ -Q-15
C-31	Me	—	c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-32	Me	—	i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-33	Cl	—	c-Pro	CHMe(3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-34	Cl	—	2,4-F ₂ -Ph	CHMe(3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-35	Me	—	2,4-F ₂ -Ph	CH ₂ (3,5-Cl ₂ -4-CO ₂ Me-Q-2)
C-36	Me	—	2,4-F ₂ -Ph	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
C-37	Cl	—	i-Pro	CHMe(3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-38	Cl	—	CF ₃	CHMe(3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-39	Me	—	C ₂ F ₅	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-40	Me	—	Et	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-41	Me	—	2-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-42	Me	—	i-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-43	Me	—	CH ₂ -t-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-44	Me	—	t-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-45	Me	—	c-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)

【0072】

【表3】

化合物No.	R ¹	R ²	X R ³	Q
C-46	Me	—	CCl ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-47	Me	—	2-Me-Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-48	Me	—	3-Me-Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-49	Me	—	4-Me-Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-50	Me	—	2-Cl-Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-51	Me	—	3-Cl-Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-52	Me	—	4-Cl-Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-53	Me	—	-CH=CHCl(cis)	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-54	Me	—	c-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-55	Me	—	i-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-56	Me	—	CF ₃	3-CF ₃ -Q-2
C-57	OMe	—	c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-58	OMe	—	i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)

C-59	OMe	—	CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-60	Cl	—	c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-61	Cl	—	i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-62	Cl	—	CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-63	Me	—	CF ₃	4-CF ₃ -Q-6
C-64	Me	—	c-Pro	4-CF ₃ -Q-6
C-65	Me	—	i-Pro	4-CF ₃ -Q-6
C-66	Me	—	2,4-F ₂ -Ph	4-CF ₃ -Q-6
C-67	Me	—	1-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-68	Me	—	CF ₂ Cl	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)

【0073】

【表4】

化合物No.	R ¹	R ²	X R ³	Q
C-69	Me	—	-CMe=CH ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-70	Me	—	CHCl ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-71	Me	—	CBr ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-72	Me	—	CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-73	Me	—	CCl ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-74	Me	—	2,4-Cl ₂ -Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-75	Me	—	c-Pro	3-CF ₃ -5-OMe-Q-2
C-76	Me	—	i-Pro	3-CF ₃ -5-OMe-Q-2
C-77	Me	—	2-Me-c-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-78	Me	—	t-Bu	3-CF ₃ -Q-2
C-79	Me	—	CCl ₃	3-CF ₃ -Q-2
C-80	Me	—	-CH=CMe ₂	3-CF ₃ -Q-2
C-81	Me	—	CHF ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-82	Me	—	2,2,3,3-Me ₄ -c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-83	Me	—	CF ₃	3-CF ₃ -5-OMe-Q-2
C-84	OMe	—	c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-85	OMe	—	i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-86	OMe	—	CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-87	Cl	—	c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-88	Cl	—	CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-89	Me	—	CF ₂ Cl	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-90	Me	—	C ₂ F ₅	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-91	Me	—	2-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

【0074】

【表5】

化合物No.	R ¹	R ²	X R ³	Q
C-92	Me	—	t-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-93	Cl	—	c-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-94	Cl	—	i-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-95	Cl	—	CF ₃	3-CF ₃ -Q-2
C-96	Cl	—	O-i-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-97	Me	—	1-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-98	Me	—	Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

C-99	Me	—	CMe=CH ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-100	Me	—	t-Pen	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-101	Me	—	CMe ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-102	Me	—	CClMeCH ₂ Cl	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-103	Me	—	2-F-Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-104	Me	—	2, 4-F ₂ -Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-105	Me	—	OEt	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-106	Me	—	CH ₂ CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-107	Me	—	CCl=CCl ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-108	Me	—	2, 2-Cl ₂ -3-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-109	Me	—	2-CF ₃ -Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-110	Me	—	O-t-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-111	Me	—	NMe ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-112	Me	—	NHMe	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-113	Me	—	CHClMe	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-114	Me	—	CCF ₃ =CH ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)

【0075】

【表6】

化合物No.	R ¹	R ²	X R ³	Q ₁
C-115	Me	—	CMe ₂ CHCl ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-116	Me	—	CMe (CH ₂ Cl) ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-117	Me	—	CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-118	Me	—	OMe	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-119	Me	—	O-i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-120	OMe	—	CF ₂ Cl	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-121	Me	—	CF ₂ Cl	3-CF ₃ -Q-2
C-122	Me	—	s-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-123	Me	—	CHMeOMe	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-124	OMe	—	c-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-125	OMe	—	i-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-126	OMe	—	-CH=CMe ₂	3-CF ₃ -Q-2
C-127	OMe	—	CF ₃	3-CF ₃ -Q-2
C-128	OMe	—	CCl ₃	3-CF ₃ -Q-2
C-129	OMe	—	CBr ₃	3-CF ₃ -Q-2
C-130	Me	—	-CCl=CH ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-131	Me	—	-CH=CHCl (E)	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-132	Me	—	CHFC1	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-133	Me	—	Me	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-134	Me	—	Et	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-135	Me	—	Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-136	Me	—	Pen	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-137	Me	—	CH ₂ CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

【0076】

【表7】

化合物No.	R ¹	R ²	X R ³	Q
C-138	Me	—	NEt ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

C-139	Me	—	NMePh	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-140	Me	—	CF ₂ CF ₂ Cl	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-141	Me	—	CF ₂ CF ₂ H	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-142	Me	—	CMe(CF ₃) ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-143	Me	—	c-Pro	CH ₂ (3-C ₂ F ₅ -Q-2)
C-144	Me	—	i-Pro	CH ₂ (3-C ₂ F ₅ -Q-2)
C-145	Me	—	CF ₃	CH ₂ (3-C ₂ F ₅ -Q-2)
C-146	Me	—	CF ₂ Cl	CH ₂ (3-C ₂ F ₅ -Q-2)
C-147	OMe	—	2-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-148	OMe	—	t-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-149	OMe	—	2,4-F ₂ -Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-150	OMe	—	CCl ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-151	OMe	—	C ₂ F ₅	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-152	OMe	—	OEt	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-153	OMe	—	CH ₂ CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-154	OMe	—	1-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-155	OMe	—	CMe=CH ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-156	Cl	—	t-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-157	Cl	—	CCl ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-158	Cl	—	CF ₂ Cl	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-159	Cl	—	2-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-160	Cl	—	1-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

【0077】

【表8】

化合物No.	R ¹	R ²	X R ³	Q
C-161	Cl	—	CMe=CH ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-162	Cl	—	2,4-F ₂ -Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-163	Cl	—	OEt	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-164	Me	—	OCH ₂ CCl ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-165	Cl	—	CH ₂ CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-166	Cl	—	CF ₂ CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-167	Me	—	CH=CHCF ₃ (E)	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-168	Me	—	CF ₂ Br	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

【0078】 〔表1-b〕

【表9】

【0079】

化合物No.	R ¹	R ²	X R ³	A	Q
(A ≠ Hの場合)					
D-1	Me	—	c-Pro	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-2	Me	—	c-Pro	-CO-i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-3	Me	—	c-Pro	-CO-Me	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-4	Me	—	Et	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-5	Me	—	Pro	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-6	Me	—	i-Pro	-CO-i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-7	Me	—	c-Pro	-CO-c-Pro	3-CF ₃ -Q-2
D-8	Me	—	Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

D-9	Me	—	c-Pro	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
D-10	Me	—	2-Me-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-11	Me	—	3-Me-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-12	Me	—	4-Me-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-13	Me	—	2-Cl-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-14	Me	—	3-Cl-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-15	Me	—	4-Cl-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-16	Me	—	c-Pro	-CO-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-17	Me	—	c-Pro	-CO-t-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-18	Me	—	c-Pro	-CO ₂ Me	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-19	Me	—	c-Pro	-COPen	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-20	Me	—	c-Pro	-CO-2-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

【0080】

【表10】

化合物No.	R ¹	R ²	X R ³	A	Q
D-21	Me	—	c-Pro	-CO-1-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-22	Me	—	NMe ₂	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-23	Me	—	4-OMe-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-24	Me	—	4-NO ₂ -Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-25	Cl	—	c-Pro	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-26	MeO	—	c-Pro	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-27	Me	—	4-CF ₃ -Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-28	Me	—	4-CN-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-29	Me	—	4-F-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

【0081】 (表2-a)

【表11】

【0082】

化合物 No.	物理的性質
C-1	融点 117-119℃
C-2	融点 133-136℃
C-3	融点 139-141℃
C-4	融点 142-143℃
C-5	融点 130-131℃
C-6	融点 106-108℃
C-7	融点 164-166℃
C-8	融点 125-128℃
C-9	融点 113-115℃
C-10	融点 119-121℃
C-11	融点 158-160℃
C-12	融点 134-135℃
C-13	融点 192-193℃
C-14	融点 193-194℃
C-15	融点 147-148℃
C-16	融点 137-138℃
C-17	融点 86- 88℃
C-18	融点 77- 78℃

C-19	熔点	135-139℃
C-20	熔点	139-142℃
C-21	熔点	139-141℃

【0083】

【表12】

化合物 No.	物理的性質
C-22	熔点 151-153℃
C-23	熔点 135-137℃
C-24	熔点 214-215℃
C-25	熔点 159-162℃
C-26	熔点 122-123℃
C-27	熔点 184-186℃
C-28	熔点 98-100℃
C-29	熔点 133-135℃
C-30	熔点 98-100℃
C-31	熔点 144-148℃
C-32	熔点 127-128℃
C-33	熔点 143-145℃
C-34	粘稠液体 $^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 1.93(d, 3H, J=7Hz), 2.28(s, 3H), 5.59(t, 1H, J=7Hz), (CDCl_3) 6.32(s, 1H), 6.75-7.45(m, 4H), 7.70-8.19(m, 2H), 9.50(m, 1H)
C-35	熔点 170-171℃
C-36	100-101℃
C-37	粘稠液体 $^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 1.27(d, 6H, J=6.8Hz), 1.93(d, 3H, J=7Hz), 2.40-2.90 (CDCl_3) (m, 1H), 5.50(t, 1H, J=7Hz), 6.34(s, 1H), 7.09-7.36 (m, 2H), 7.83-8.11(m, 1H), 9.70(br s, 1H)

【0084】

【表13】

化合物 No.	物理的性質
C-38	粘稠液体 $^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 1.93(d, 3H, J=7Hz), 2.44(s, 3H), 5.46(t, 1H, J=7Hz), (CDCl_3) 7.26-7.60(m, 2H), 7.90-8.14(m, 1H), 11.75(br s, 1H)
C-39	粘稠液体 $^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 2.34(s, 3H), 2.45(s, 3H), 5.13(s, 2H), 6.29(s, 1H), (CDCl_3) 7.10-7.30(m, 2H), 7.75-8.00(m, 1H), 11.38(br s, 1H)
C-40	熔点 115-117℃
C-41	熔点 138-139℃
C-42	熔点 99-100℃
C-43	熔点 138-139℃
C-44	熔点 133-135℃
C-45	熔点 117-120℃
C-46	熔点 114-115℃
C-47	熔点 132-133℃
C-48	熔点 145-146℃

C-49	融点	185-186℃
C-50	融点	134-137℃
C-51	融点	147-150℃
C-52	融点	191-194℃
C-53	融点	121-124℃
C-54	融点	110-111℃
C-55	融点	101-102℃
C-56	融点	131-132℃

【0085】

【表 14】

化合物 No.	物理的性質
C-57	融点 125-128℃
C-58	融点 129-130℃
C-59	融点 117-118℃
C-60	融点 138-139℃
C-61	融点 125-126℃
C-62	融点 118-119℃
C-63	融点 171-172℃
C-64	融点 260-261℃
C-65	融点 239-240℃
C-66	融点 205-206℃
C-67	融点 146-149℃
C-68	融点 107-109℃
C-69	融点 127-132℃
C-70	融点 119-121℃
C-71	融点 123-126℃
C-72	融点 163-165℃
C-73	融点 121-123℃
C-74	融点 151-152℃
C-75	融点 113-115℃
C-76	融点 91-96℃
C-77	融点 113-114℃
C-78	融点 64-65℃
C-79	融点 116-117℃

【0086】

【表 15】

化合物 No.	物理的性質
C-80	融点 95-96℃
C-81	融点 140-143℃
C-82	融点 150-153℃
C-83	融点 97-99℃
C-84	融点 166-167℃
C-85	融点 122-123℃
C-86	融点 139-140℃
C-87	融点 143-144℃
C-88	粘稠液体

$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 5.25 (s, 2H), 6.37-6.63 (m, 1H), 7.10-8.00 (m, 4H),
(CDCl_3) 11.21 (br s, 1H)

C-89	熔点	144-145°C
C-90	熔点	110-111°C
C-91	熔点	148-149°C
C-92	熔点	132-133°C
C-93	熔点	109-111°C
C-94	熔点	79- 81°C
C-95	熔点	107-109°C
C-96	熔点	69- 72°C
C-97	熔点	170-171°C
C-98	熔点	104-105°C
C-99	熔点	155-156°C
C-100	熔点	159-160°C

【0087】

【表 1 6】

化合物 No.	物理的性質
C-101	熔点 123-124°C
C-102	熔点 93- 94°C
C-103	熔点 126-127°C
C-104	熔点 120-121°C
C-105	熔点 112-113°C
C-106	熔点 150-152°C
C-107	熔点 130-132°C
C-108	熔点 111-112°C
C-109	熔点 136-137°C
C-110	熔点 89- 90°C
C-111	熔点 167-168°C
C-112	熔点 173-174°C
C-113	熔点 99-101°C
C-114	熔点 95- 96°C
C-115	粘稠液体
$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 1.60 (s, 6H), 2.27 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 5.06 (s, 2H), (CDCl_3) 6.21 (s, 1H), 6.29 (s, 1H), 6.90-7.29 (m, 2H), 7.46-7.74 (m, 1H), 9.26 (br s, 1H)	
C-116	粘稠液体
$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 1.59 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 3.96 (s, 4H), (CDCl_3) 5.14 (s, 2H), 6.24 (s, 1H), 6.88-7.35 (m, 2H), 7.41-7.85 (m, 1H), 9.88 (br s, 1H)	

【0088】

【表 1 7】

化合物 No.	物理的性質
C-117	粘稠液体
$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 2.30 (s, 3H), 5.12 (s, 2H), 6.34-6.48 (m, 1H), (CDCl_3) 6.97-7.25 (m, 2H), 7.42-7.80 (m, 2H), 11.20 (br s, 1H)	
C-118	熔点 104-105°C

C-119	熔点	129-130°C
C-120	熔点	106-107°C
C-121	熔点	110-111°C
C-122	熔点	108-110°C
C-123	熔点	88- 91°C
C-124	熔点	136-138°C
C-125	熔点	95- 96°C
C-126	熔点	113-115°C
C-127	熔点	134-137°C
C-128	熔点	124-126°C
C-129	熔点	110-112°C
C-130	熔点	131-132°C
C-131	熔点	149-151°C
C-132	熔点	107-109°C
C-133	熔点	133-134°C
C-134	熔点	118-119°C
C-135	熔点	98- 99°C
C-136	熔点	94- 95°C
C-137	熔点	158-159°C

【0089】

【表18】

化合物 No.	物理的性質
C-138	熔点 124-125°C
C-139	熔点 81- 83°C
C-140	熔点 68- 69°C
C-141	熔点 87- 88°C
C-142	粘稠液体
¹ H-NMR δ (ppm) : 1.88 (3H, s), 2.32 (3H, s), 5.14 (2H, s), (CDCl ₃) 6.51 (1H, d, J=2Hz), 7.03-7.33 (2H, m), 7.45-7.70 (2H, m), 9.91 (1H, br s)	
C-143	熔点 135-136°C
C-144	熔点 147-148°C
C-145	熔点 90- 91°C
C-146	熔点 90- 91°C
C-147	熔点 175-177°C
C-148	熔点 103-105°C
C-149	熔点 117-119°C
C-150	熔点 109-111°C
C-151	熔点 86- 88°C
C-152	熔点 140-142°C
C-153	熔点 134-136°C
C-154	熔点 176-178°C
C-155	熔点 150-152°C
C-156	熔点 137-140°C
C-157	熔点 108-111°C

【0090】

【表19】

化合物 No.	物理的性質
C-158	融点 107-110℃
C-159	融点 148-150℃
C-160	融点 139-141℃
C-161	融点 137-139℃
C-162	融点 144-146℃
C-163	融点 106-108℃
C-164	融点 112-113℃
C-165	融点 140-143℃
C-166	融点 80- 82℃
C-167	融点 172-174℃
C-168	融点 119-121℃

【0091】 [表 2-b]

【表 20】

【0092】

化合物 No.	物理的性質
D-1	融点 122-123℃
D-2	融点 127-128℃
D-3	融点 70- 71℃
D-4	融点 110-111℃
D-5	融点 83- 84℃
D-6	融点 71- 72℃
D-7	融点 88- 89℃
D-8	粘稠液体
	$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 0.58-1.78 (5H, m), 2.34 (3H, s), 5.31 (2H, s), (CDCl_3) 6.53 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 6.98-7.95 (9H, m)
D-9	融点 138-140℃
D-10	融点 129-131℃
D-11	融点 133-134℃
D-12	融点 119-120℃
D-13	粘稠液体
	$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 0.50-1.59 (5H, m), 2.35 (3H, s), 5.38 (2H, s), (CDCl_3) 6.55 (1H, d, $J=2.3\text{Hz}$), 7.01-7.61 (8H, m)
D-14	粘稠液体
	$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 0.50-1.62 (5H, m), 2.36 (3H, s), 5.28 (2H, s), (CDCl_3) 6.55 (1H, d, $J=2.5\text{Hz}$), 7.03-7.90 (8H, m)

【0093】

【表 21】

化合物 No.	物理的性質
D-15	粘稠液体
	$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 0.50-1.53 (5H, m), 2.34 (3H, s), 5.26 (2H, s), (CDCl_3) 6.52 (1H, d, $J=2.3\text{Hz}$), 7.00-7.89 (8H, m)
D-16	粘稠液体
	$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 0.52-1.95 (12H, m), 2.37 (3H, s), (CDCl_3) 2.56-2.89 (2H, m), 5.17 (2H, s),

	6. 52(1H, d, J=2. 3Hz), 6. 93-7. 50(4H, m)
D-17	粘稠液体
¹ H-NMR δ (ppm):	0. 49-1. 30(5H, m), 1. 28(9H, s), 2. 28(3H, s),
(CDCl ₃)	5. 25(2H, s), 6. 54(1H, d, J=2. 4Hz),
	6. 91-7. 60(4H, m)
D-18	融点 93- 94℃
D-19	粘稠液体
¹ H-NMR δ (ppm):	0. 62-1. 88(14H, m), 2. 36(3H, s),
(CDCl ₃)	2. 58-2. 90(2H, m), 5. 17(2H, s),
	6. 52(1H, d, J=2. 2Hz), 6. 93-7. 49(4H, m)
D-20	粘稠液体
¹ H-NMR δ (ppm):	0. 48-2. 20(12H, m), 2. 35(3H, s), 5. 19(2H, s),
(CDCl ₃)	6. 52(1H, d, J=2. 3Hz), 6. 98-7. 51(4H, m)
D-21	融点 131-132℃

【0094】

【表22】

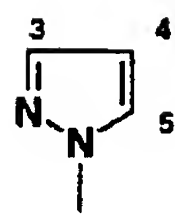
化合物 No.	物理的性質
D-22	粘稠液体
¹ H-NMR δ (ppm):	0. 51-1. 49(5H, m), 2. 31(3H, s), 3. 06(6H, s),
(CDCl ₃)	5. 47(2H, s), 6. 52(1H, d, J=2. 5Hz),
	6. 98-7. 27(3H, m), 7. 55-7. 71(1H, m)
D-23	粘稠液体
¹ H-NMR δ (ppm):	0. 53-1. 72(5H, m), 2. 26(3H, s), 3. 75(3H, s),
(CDCl ₃)	5. 22(2H, s), 6. 45(1H, d, J=2. 3Hz),
	6. 63-7. 12(5H, m), 7. 31-7. 84(3H, m)
D-24	粘稠液体
¹ H-NMR δ (ppm):	0. 51-1. 40(5H, m), 2. 37(3H, s), 5. 26(2H, s),
(CDCl ₃)	6. 48(1H, d, J=2. 7Hz), 6. 97-7. 53(4H, m),
	7. 76-8. 32(4H, m)
D-25	融点 134-136℃
D-26	融点 111-113℃
D-27	粘稠液体
¹ H-NMR δ (ppm):	0. 51-1. 38(5H, m), 2. 33(3H, s), 5. 28(2H, s),
(CDCl ₃)	6. 51(1H, d, J=2. 5Hz), 7. 04-8. 09(8H, m)
D-28	粘稠液体
¹ H-NMR δ (ppm):	0. 54-1. 38(5H, m), 2. 38(3H, s), 5. 27(2H, s),
(CDCl ₃)	6. 53(1H, d, J=2. 0Hz), 7. 00-8. 08(8H, m)
D-29	融点 107-108℃

【0095】但し、表1-a、表1-b中、Meはメチル基、Etはエチル基、Proはノルマルプロピル基、i-Proはイソプロピル基、c-Proはシクロプロピル基、Buはノルマルブチル基、i-Buはイソブチル基、s-Buはセカンダリーブチル基、t-Buはターシャリーブチル基、c-Buはシクロブチル基、Penはノルマルペンチル基、t-Penはターシャリーペンチル基、Phはフェニル基を表し、Q-2、Q-3、Q-5、Q-6、Q-15およびQ-17は下記を表

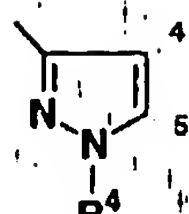
す。

【0096】

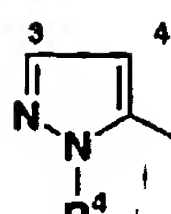
【化32】



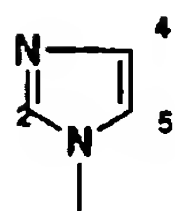
Q-2



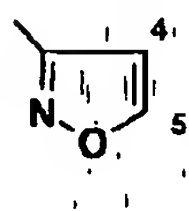
Q-3



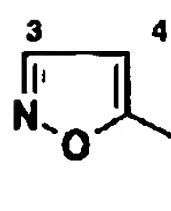
Q-5



Q-6



Q-15



Q-17

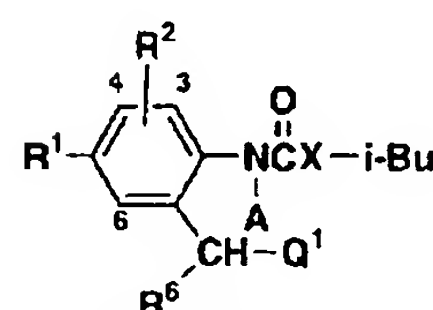
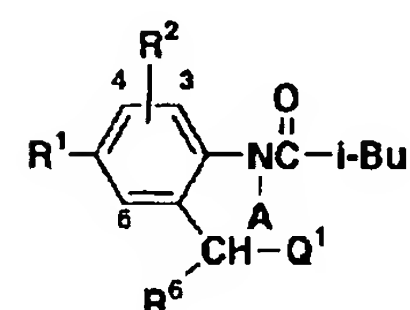
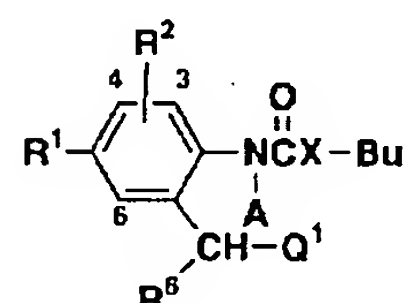
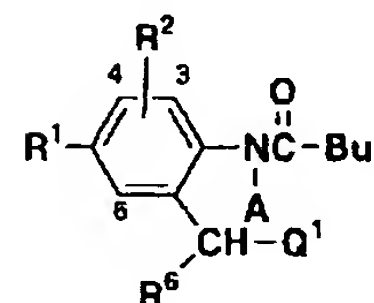
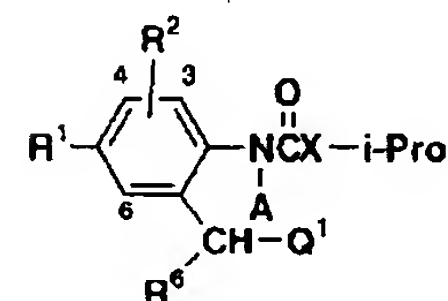
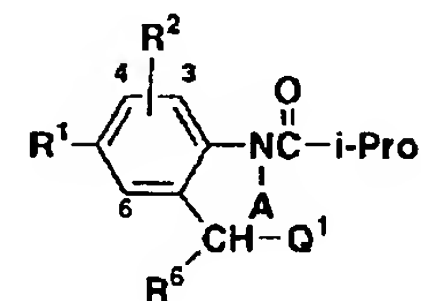
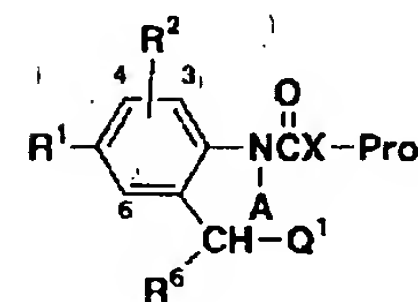
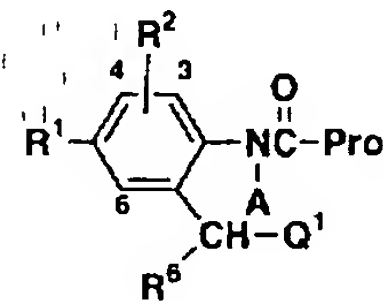
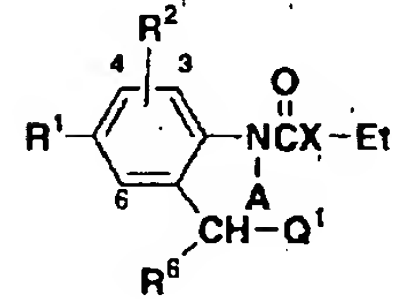
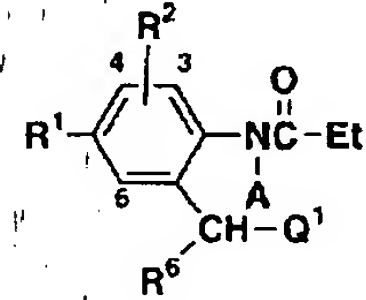
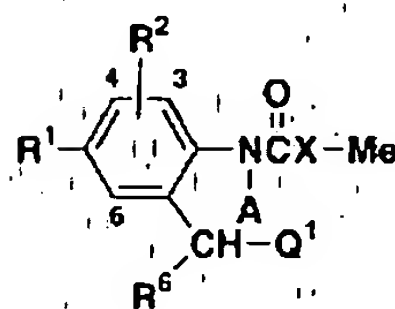
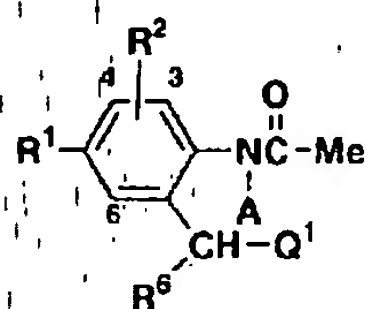
【0097】前記スキームあるいは実施例1～4に準じて合成される本発明化合物の例を、前記実施例化合物も含めて表3および表4に示すが、本発明はこれらによって限定されるものではない。尚、表3および表4中の略号は、それぞれ以下の意味を表す。

Me:メチル基、Et:エチル基、Pro:ノルマルプロピル基、i-Pro:イソプロピル基、Bu:ノルマルブチル基、i-Bu:イソブチル基、s-Bu:セカンダリーブチル基、t-Bu:ターシャリーブチル基、Pen:ノルマルペンチル基、i-Pen:イソペンチル基、s-Pen:セタンダリーペンチル基、t-Pen:ターシャリーペンチル基、Hex:ノルマルヘキシル基、Hep:ノルマルヘプチル基、c-Pro:シクロプロピル基、c-Bu:シクロブチル基、c-Pen:シクロペンチル基、c-Hex:シクロヘキシル基、c-Hep:シクロヘプチル基、c-Pente:シクロペンテニル基、c-Hexe:シクロヘキセニル基、all:アリル基を表す。

【0098】〔表3〕

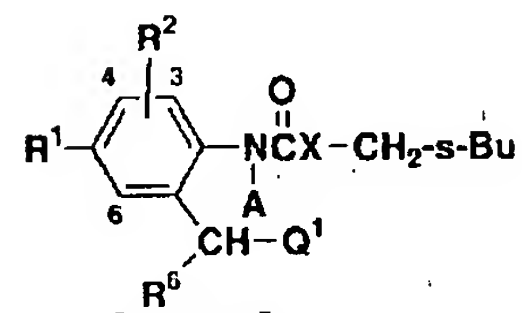
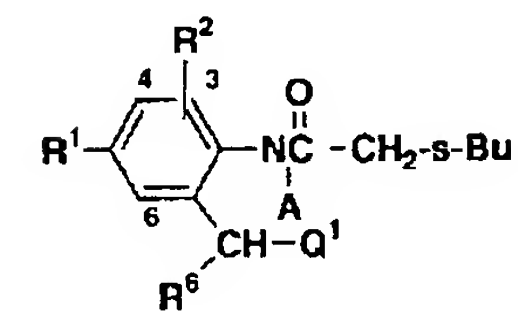
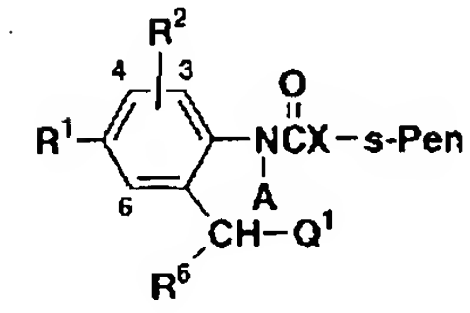
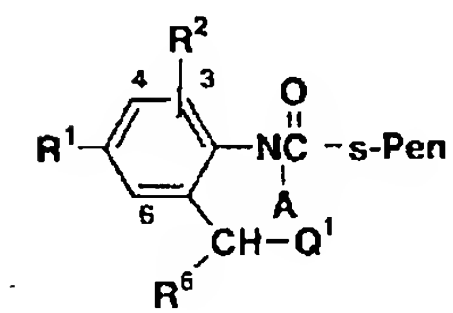
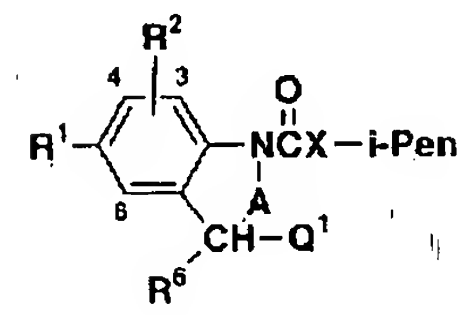
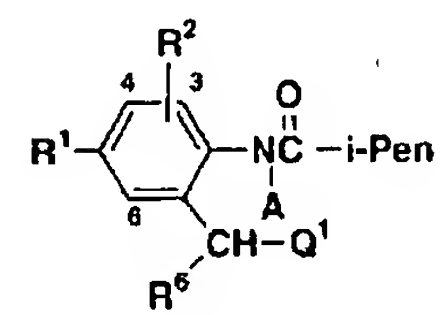
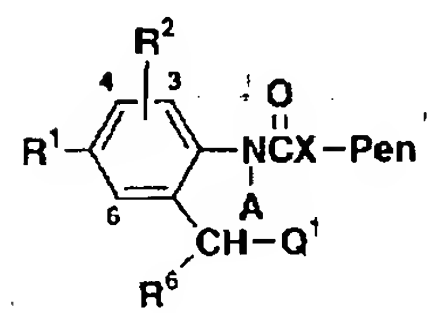
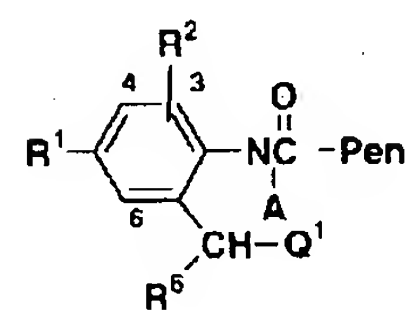
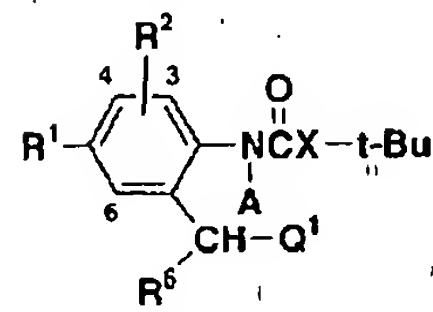
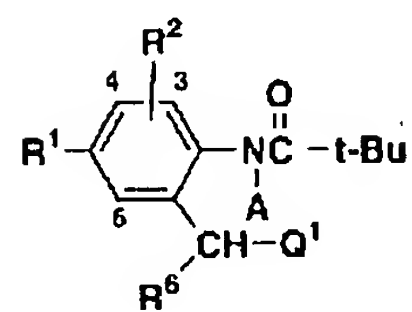
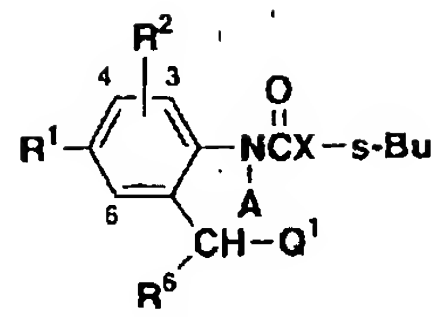
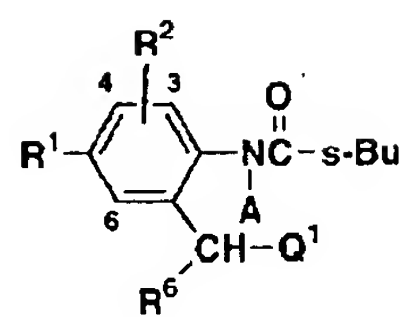
【0099】

〔化33〕



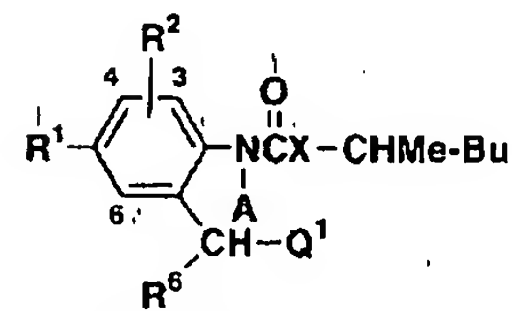
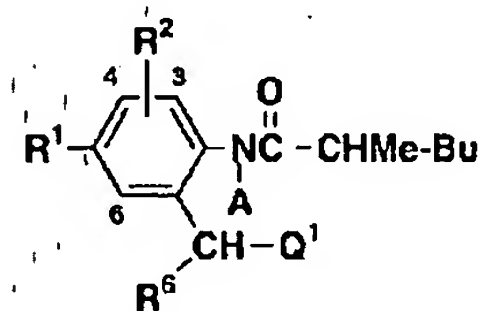
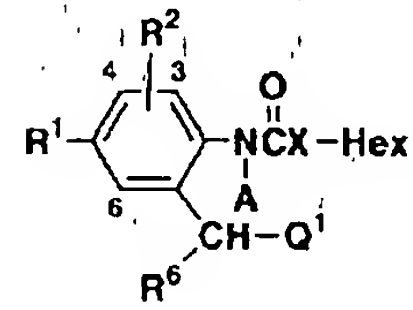
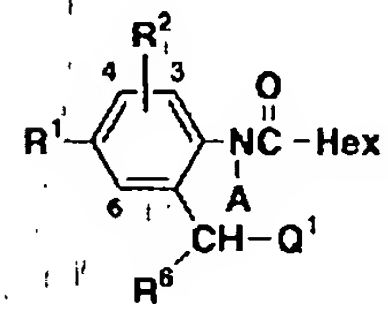
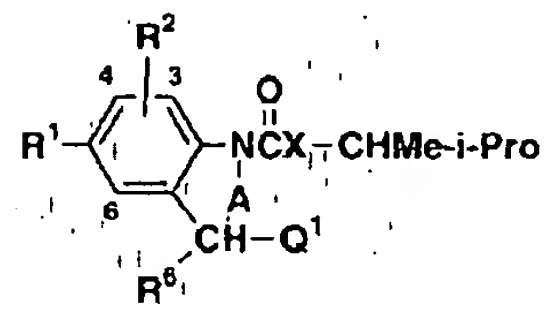
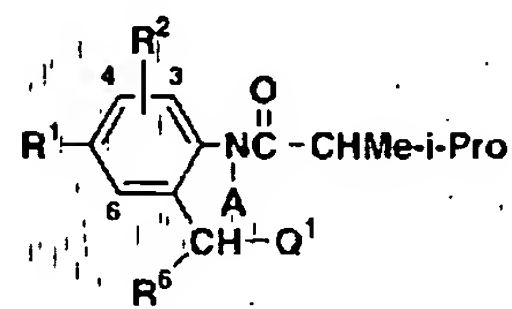
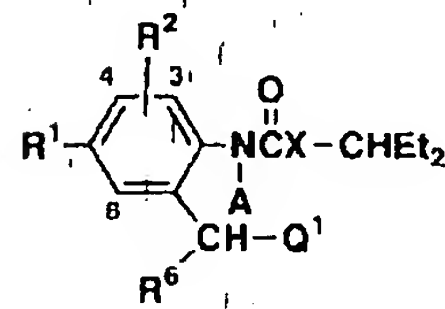
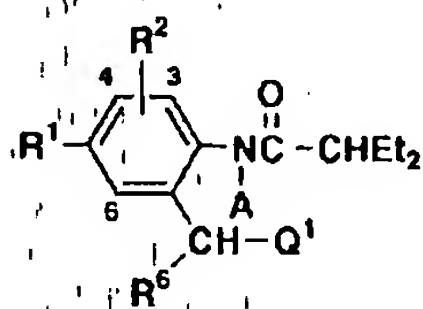
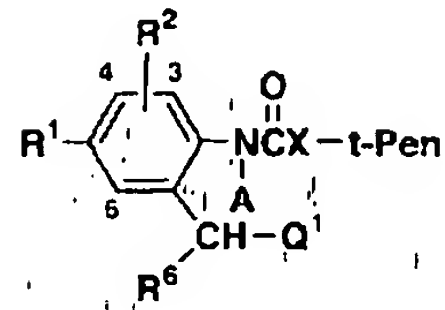
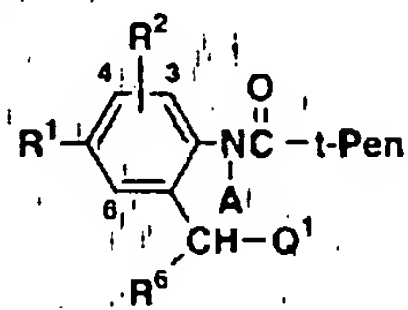
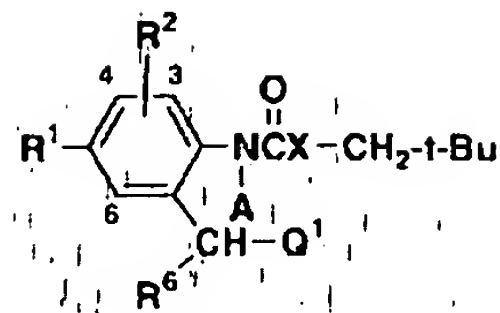
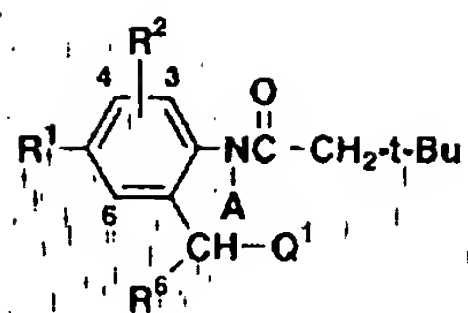
【0100】

〔化34〕



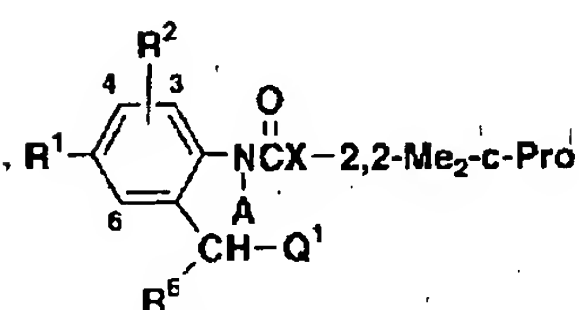
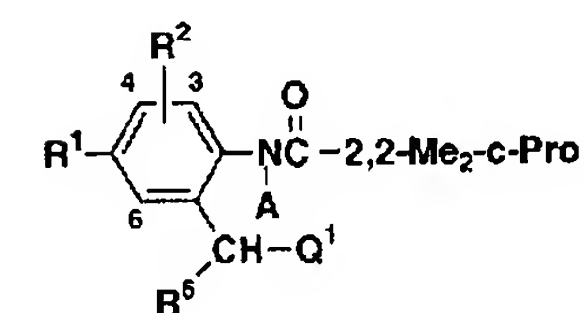
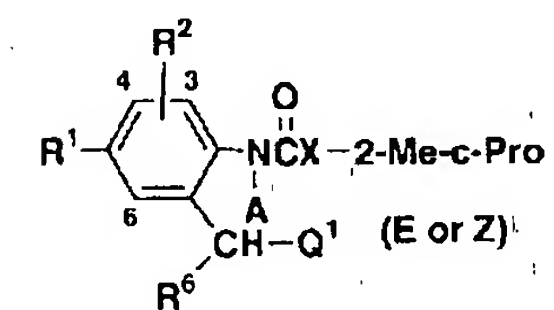
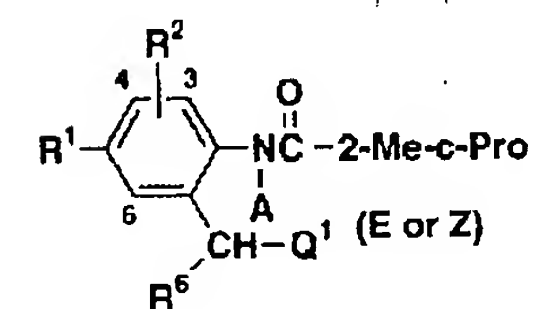
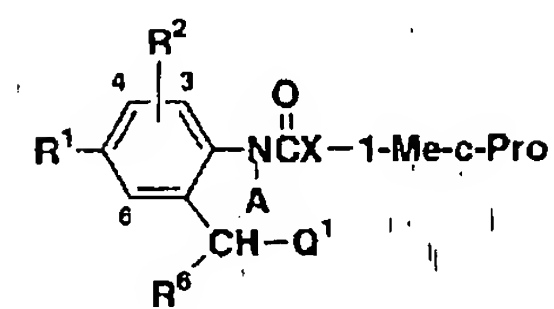
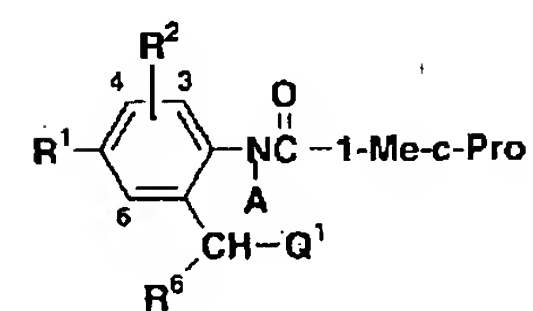
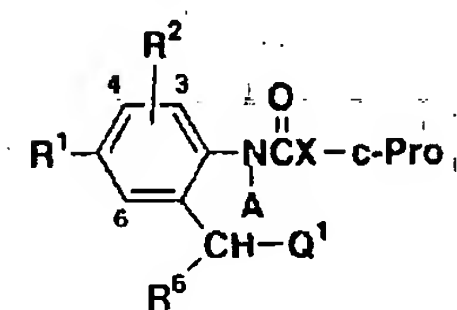
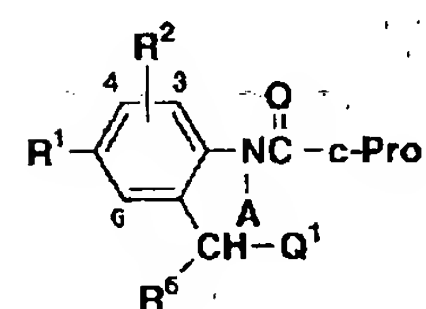
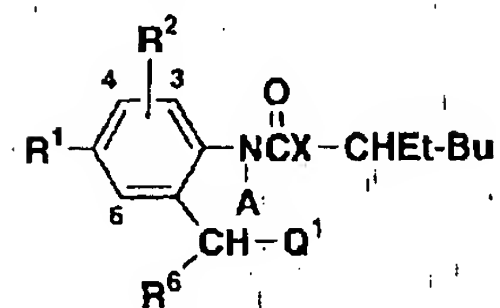
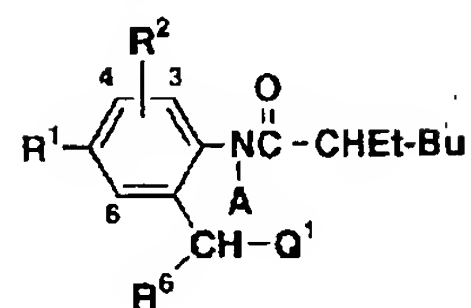
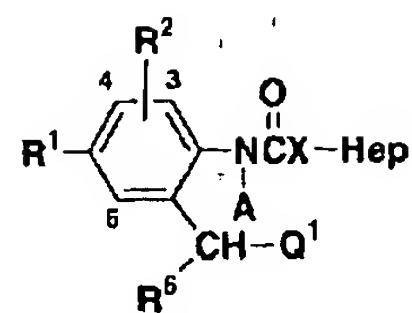
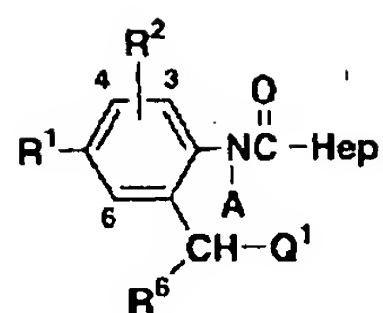
【0101】

【化35】



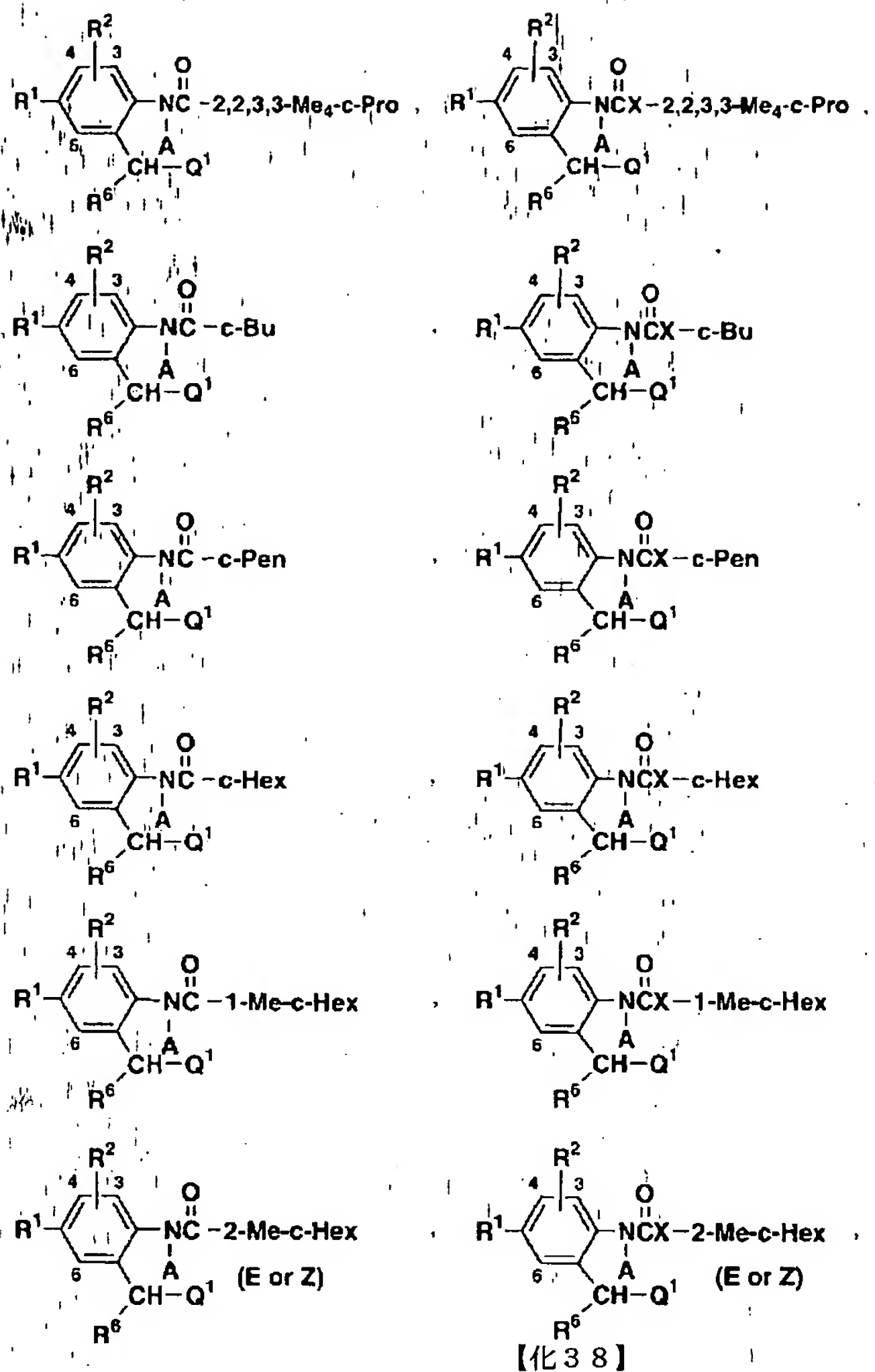
[0102]

[化36]



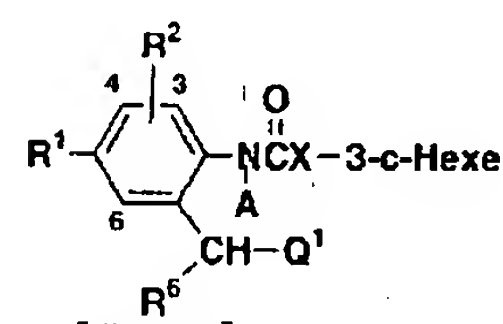
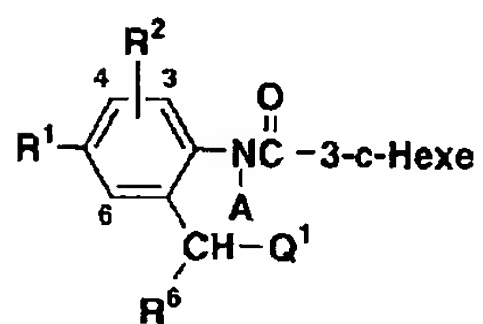
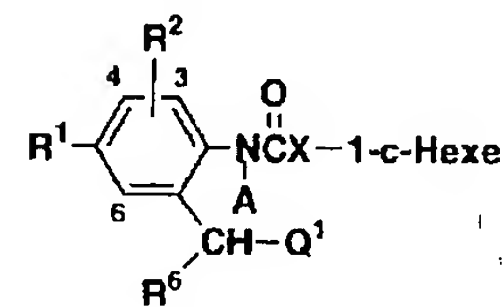
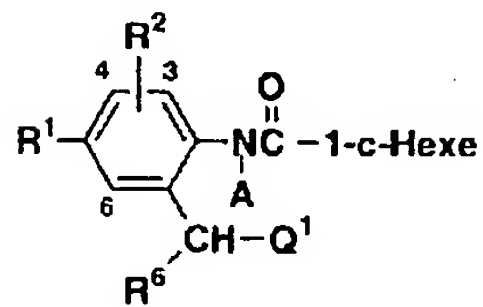
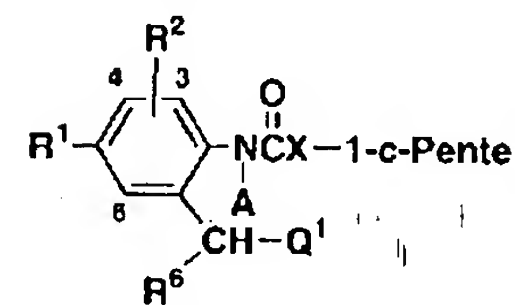
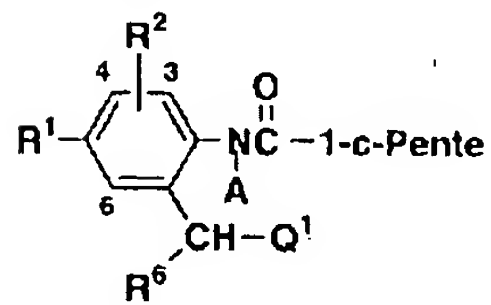
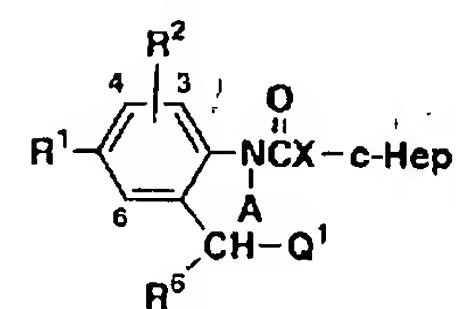
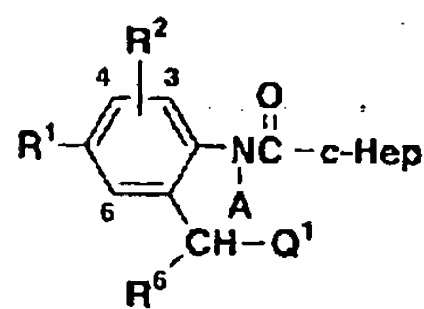
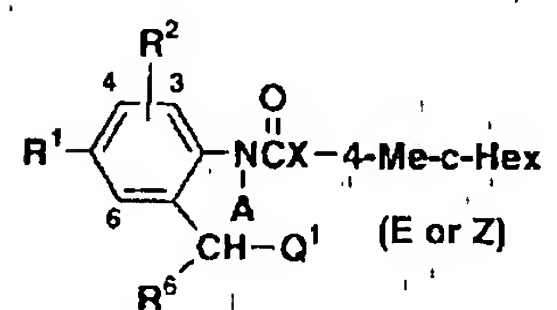
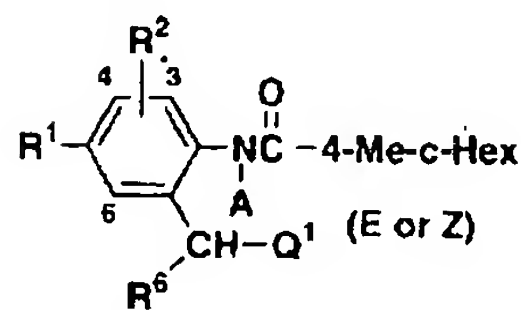
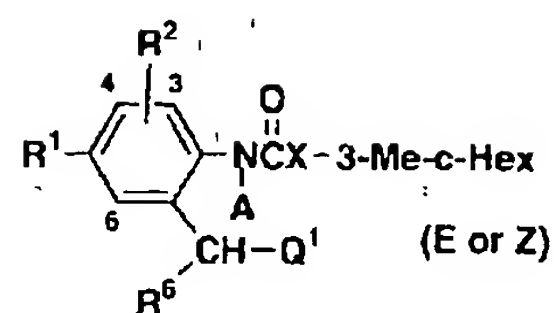
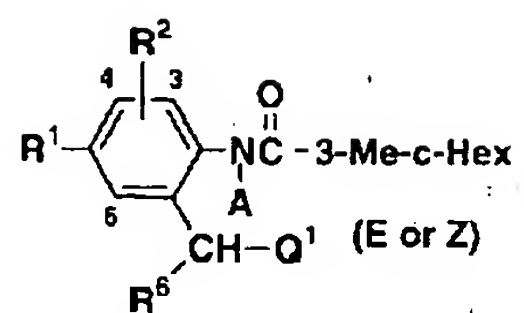
[0103]

[化37]



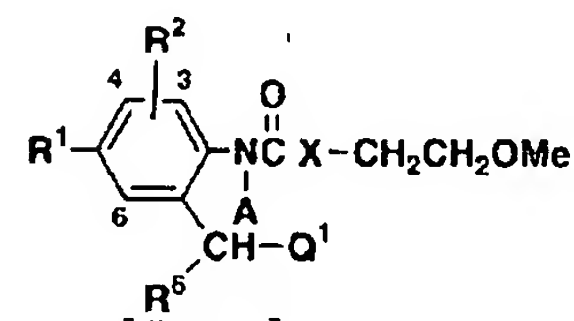
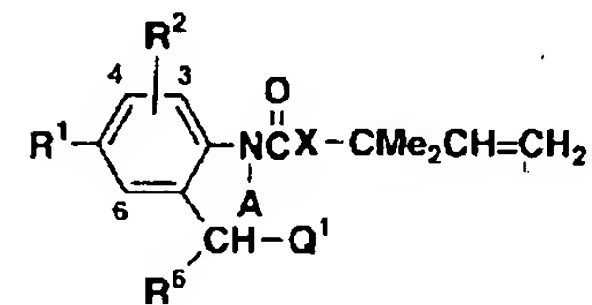
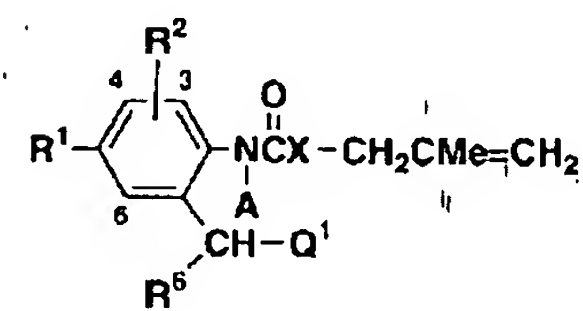
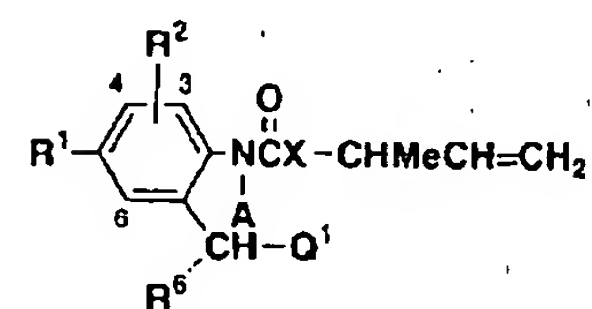
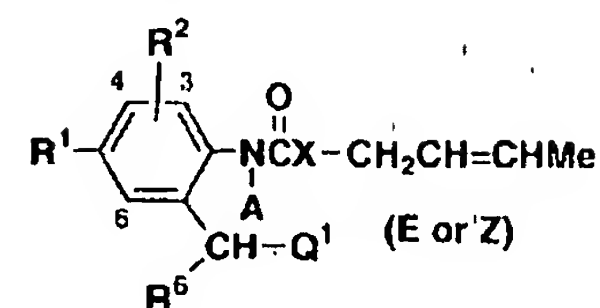
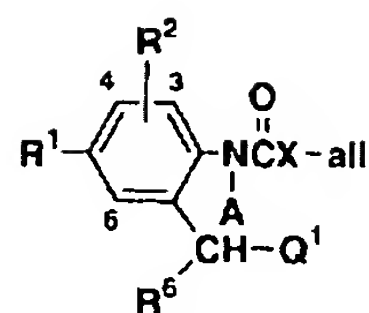
[0104]

[化38]

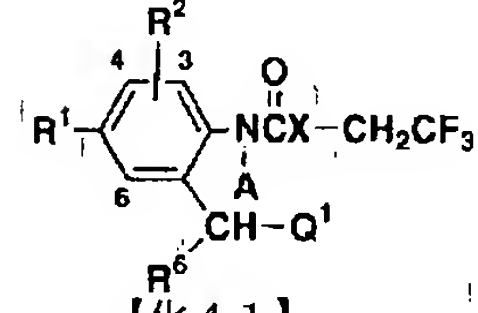
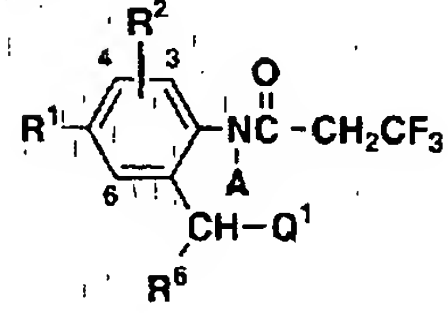
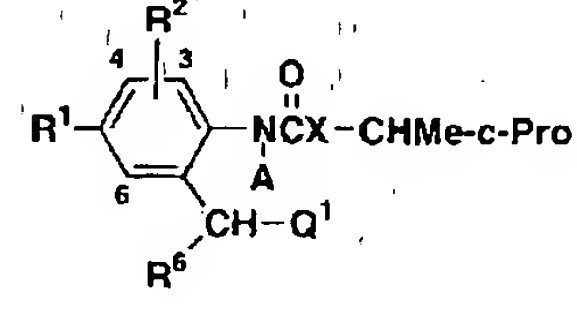
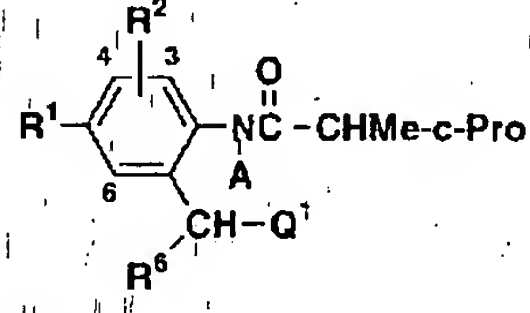
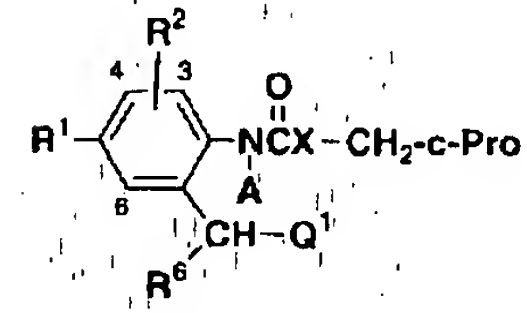
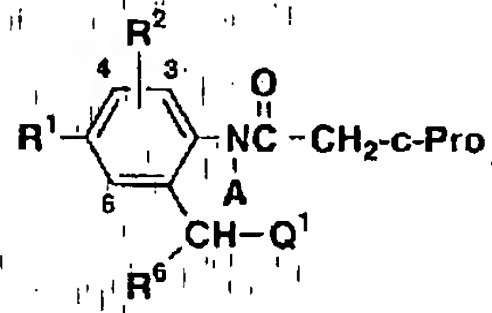
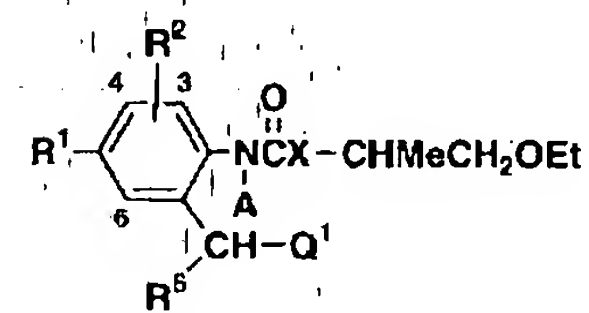
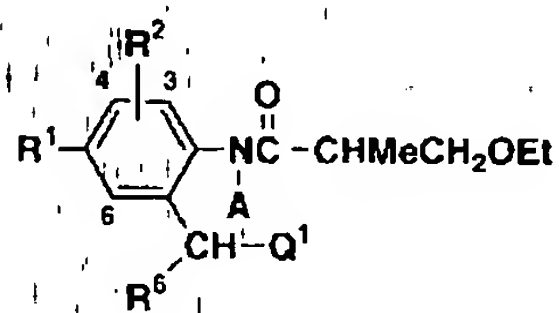
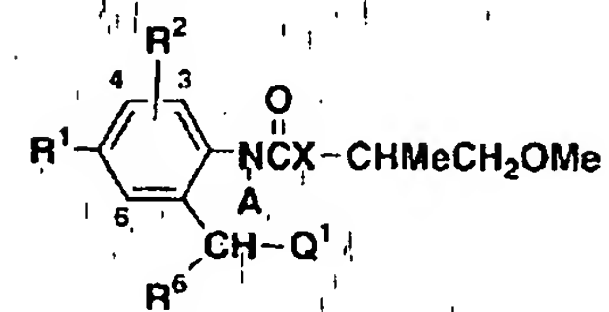
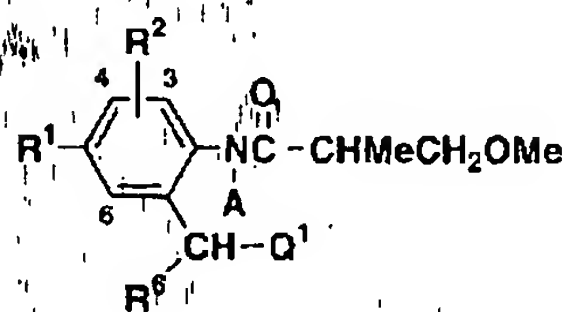
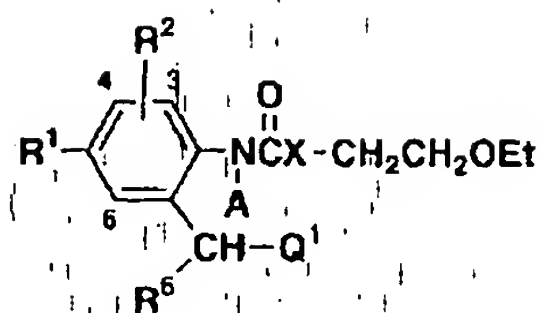
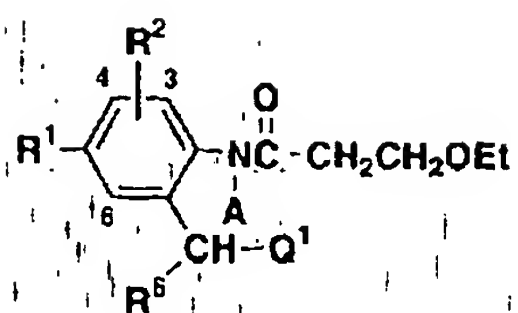


[0105]

[139]

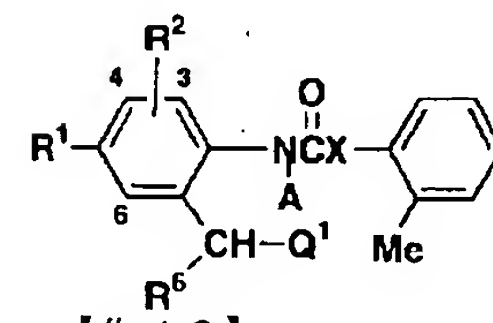
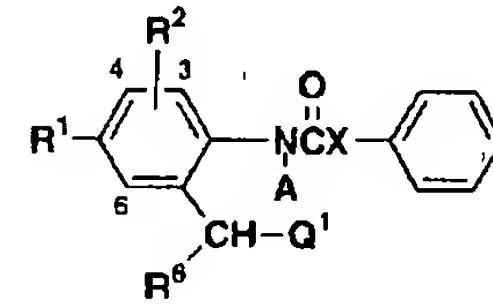
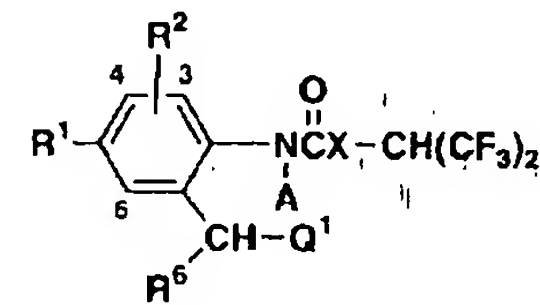
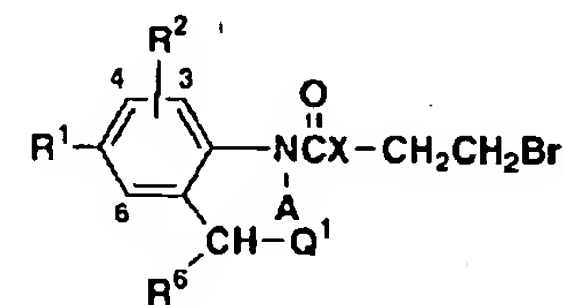
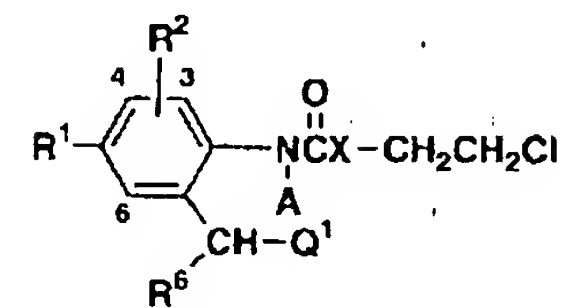
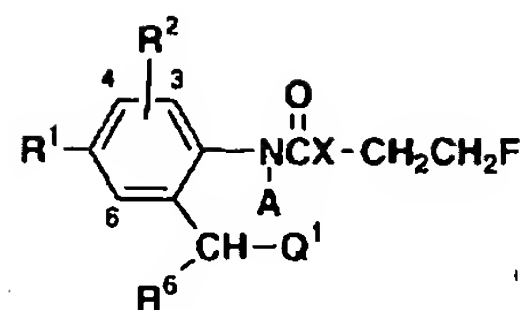
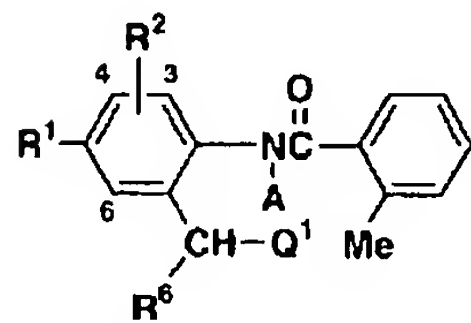
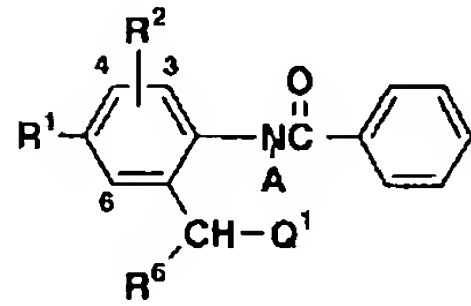
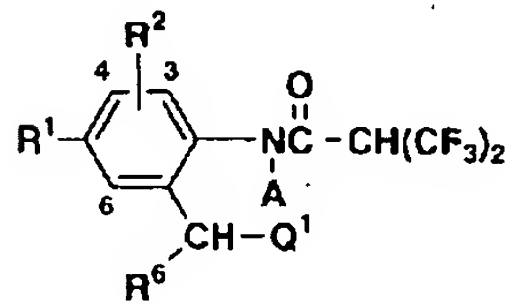
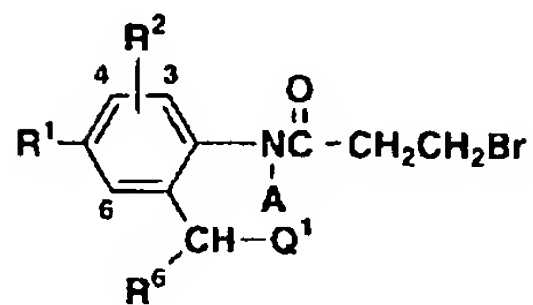
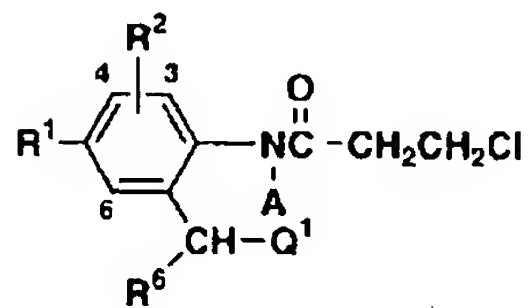
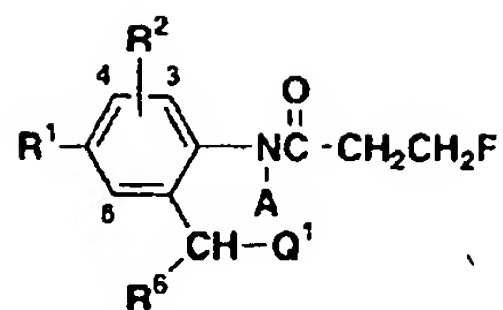


【化40】



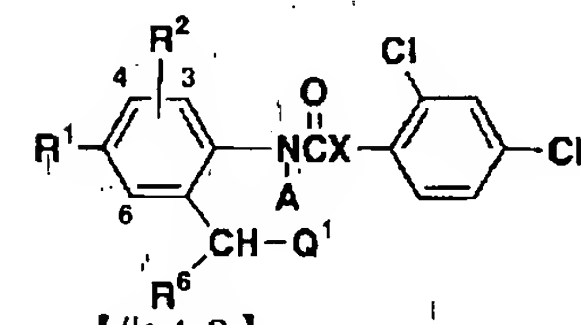
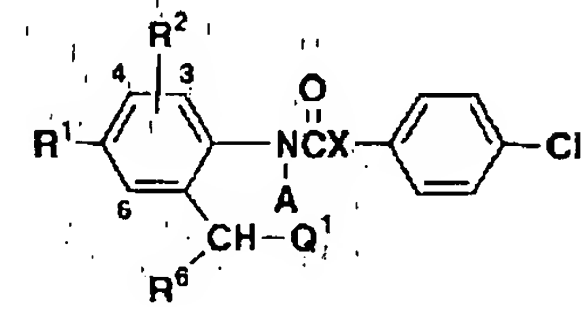
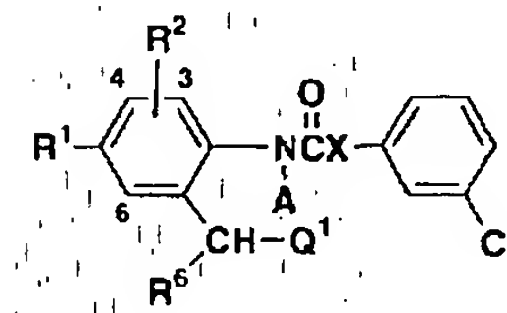
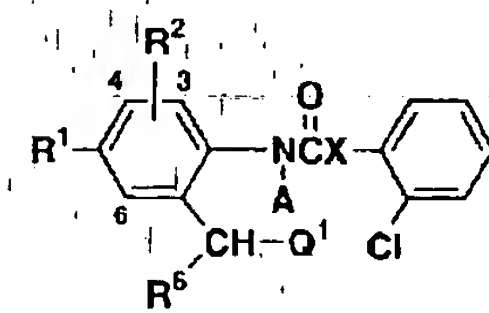
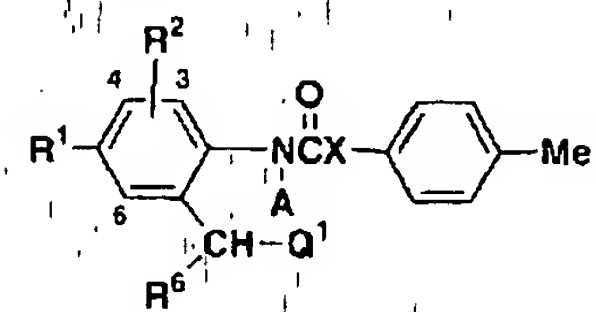
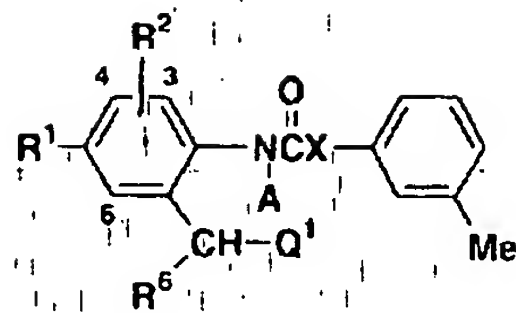
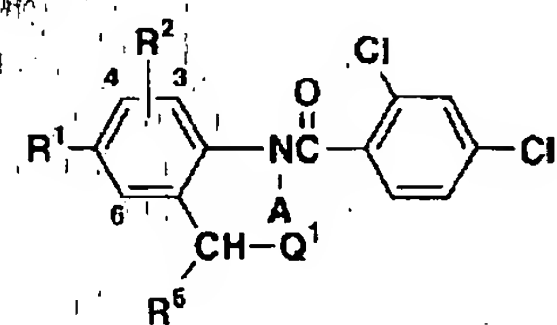
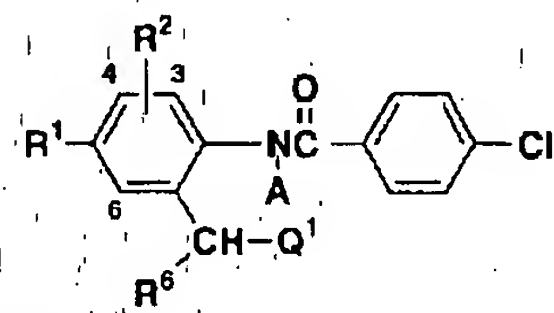
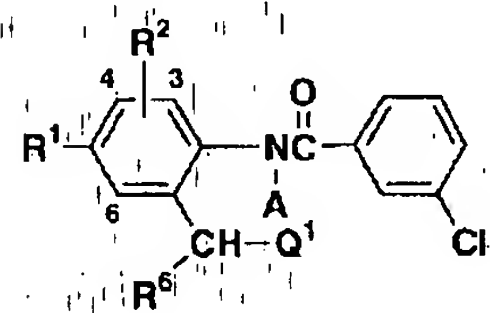
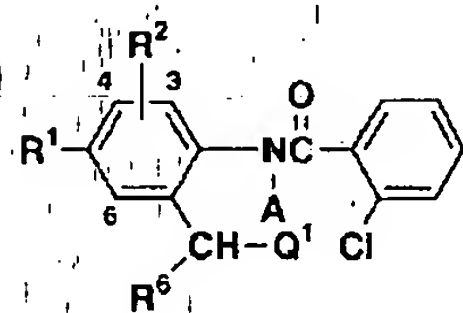
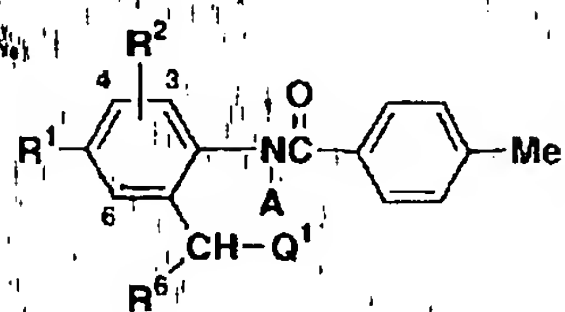
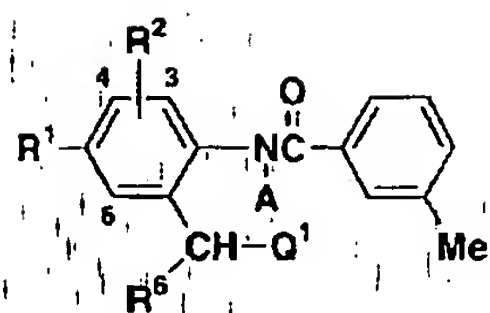
[0107]

[化41]



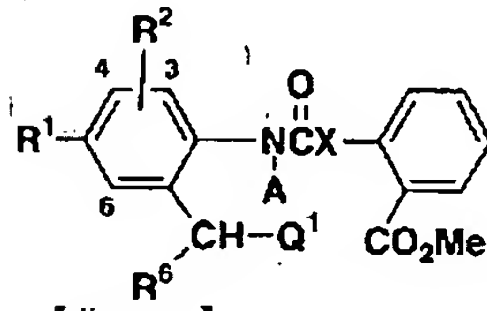
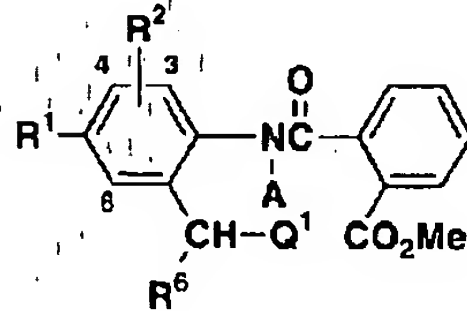
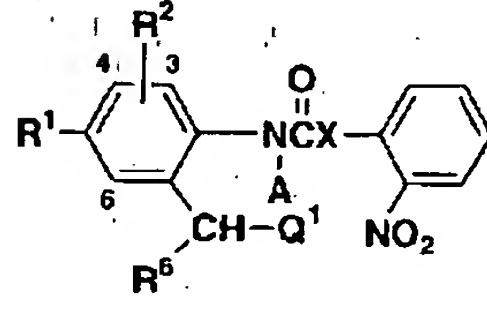
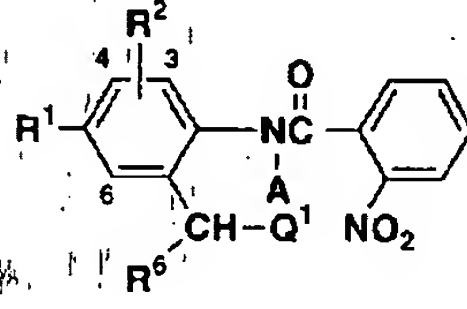
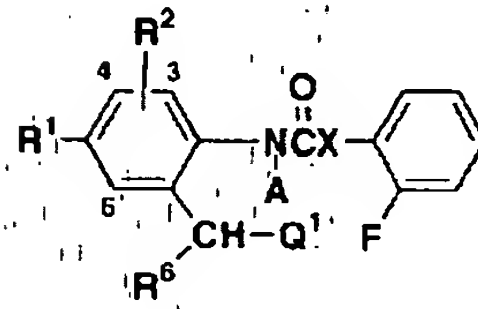
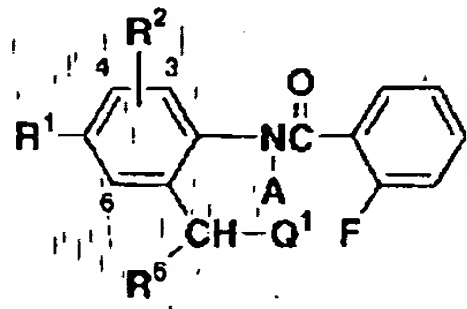
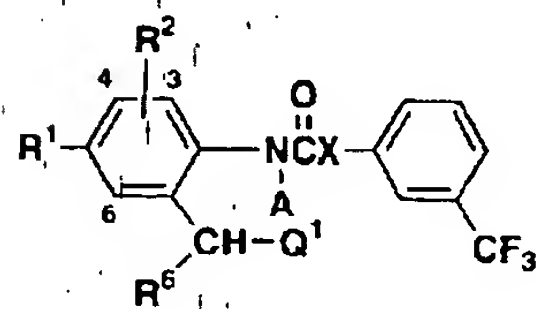
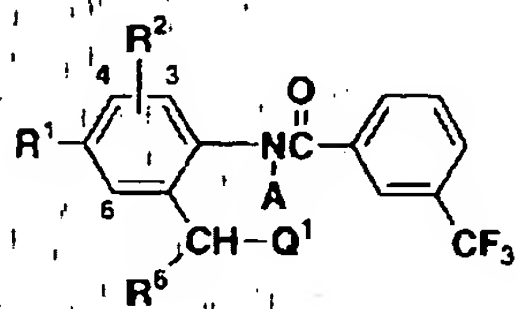
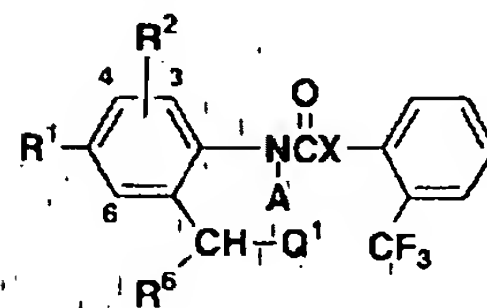
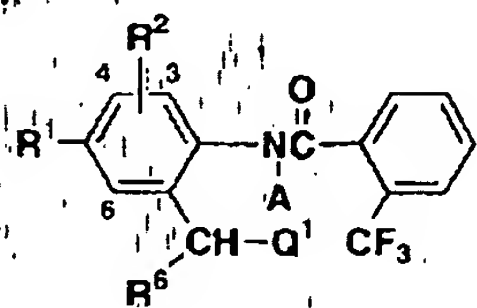
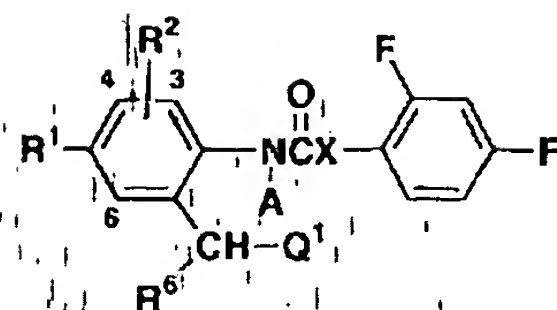
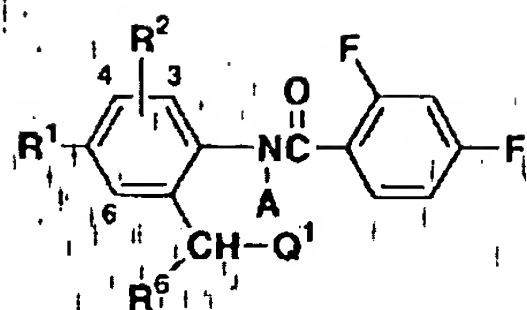
【0108】

【化42】



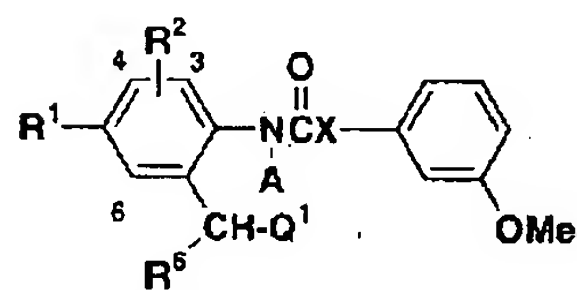
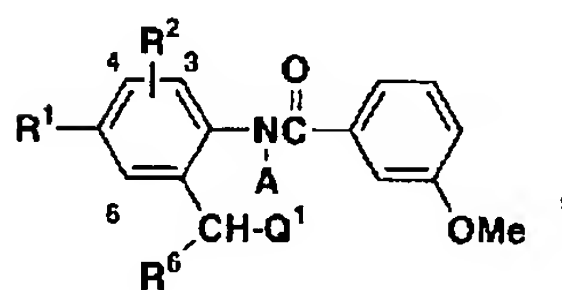
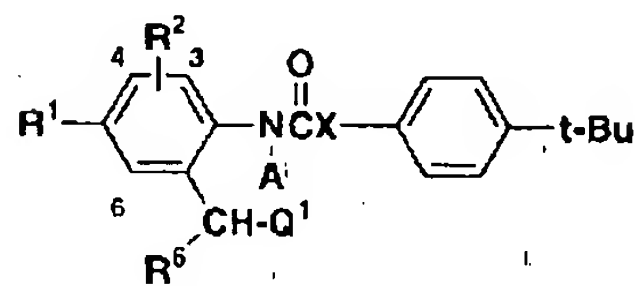
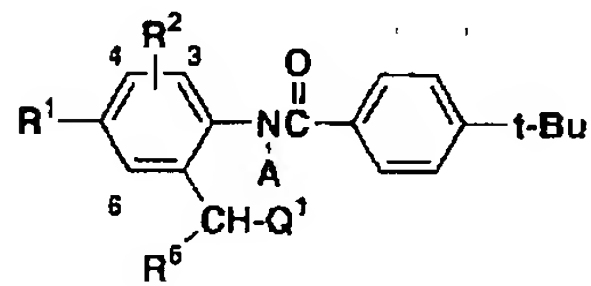
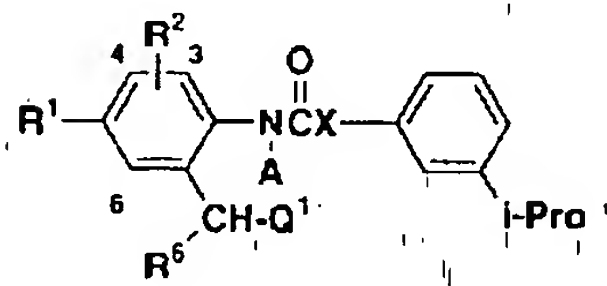
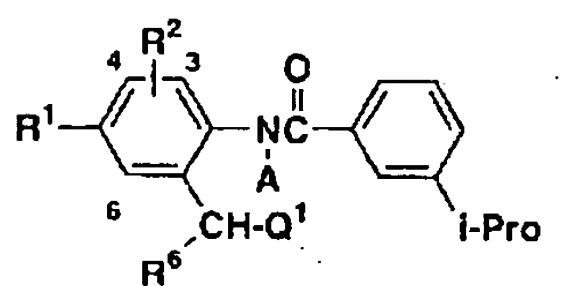
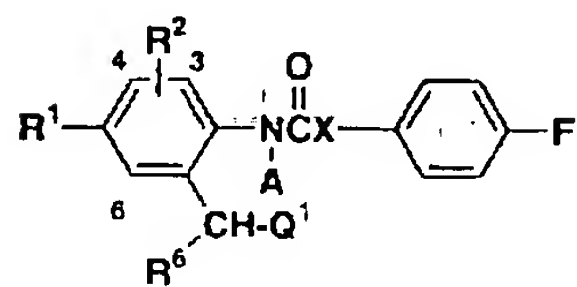
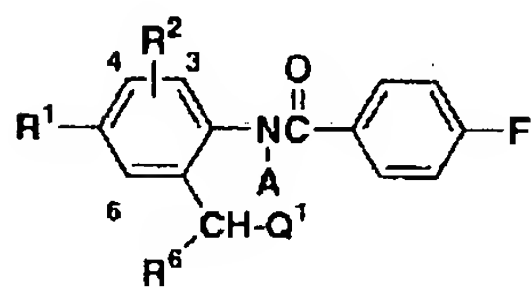
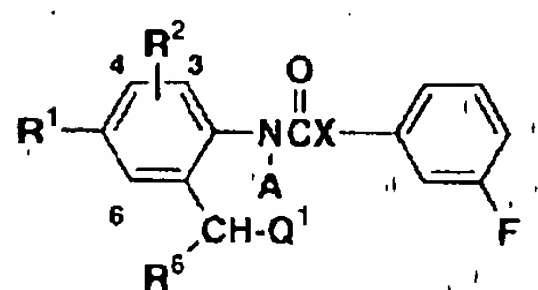
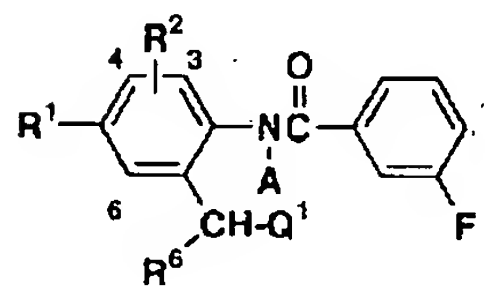
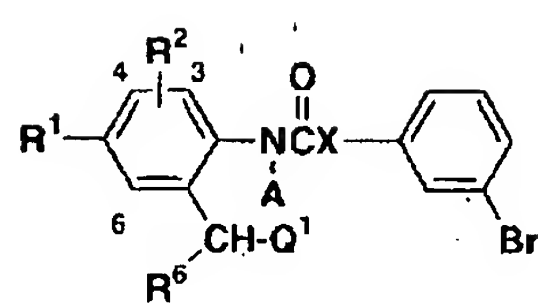
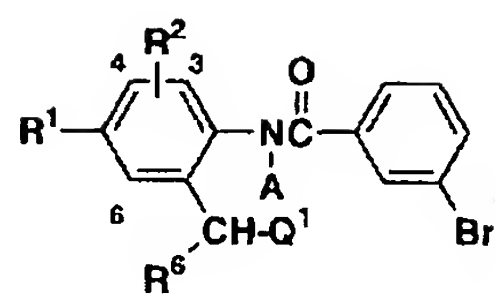
【0109】

【化43】



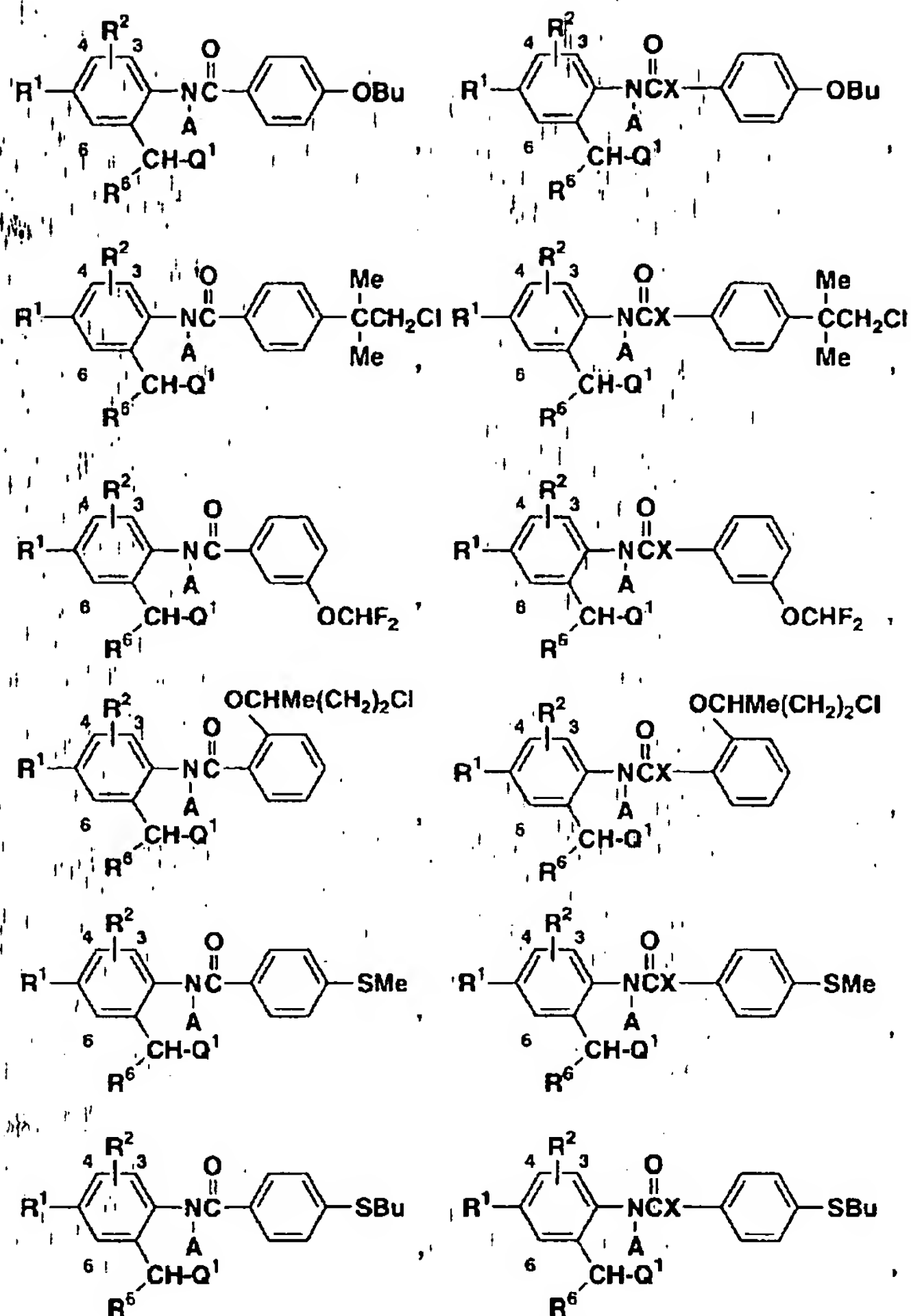
【0110】

【化44】



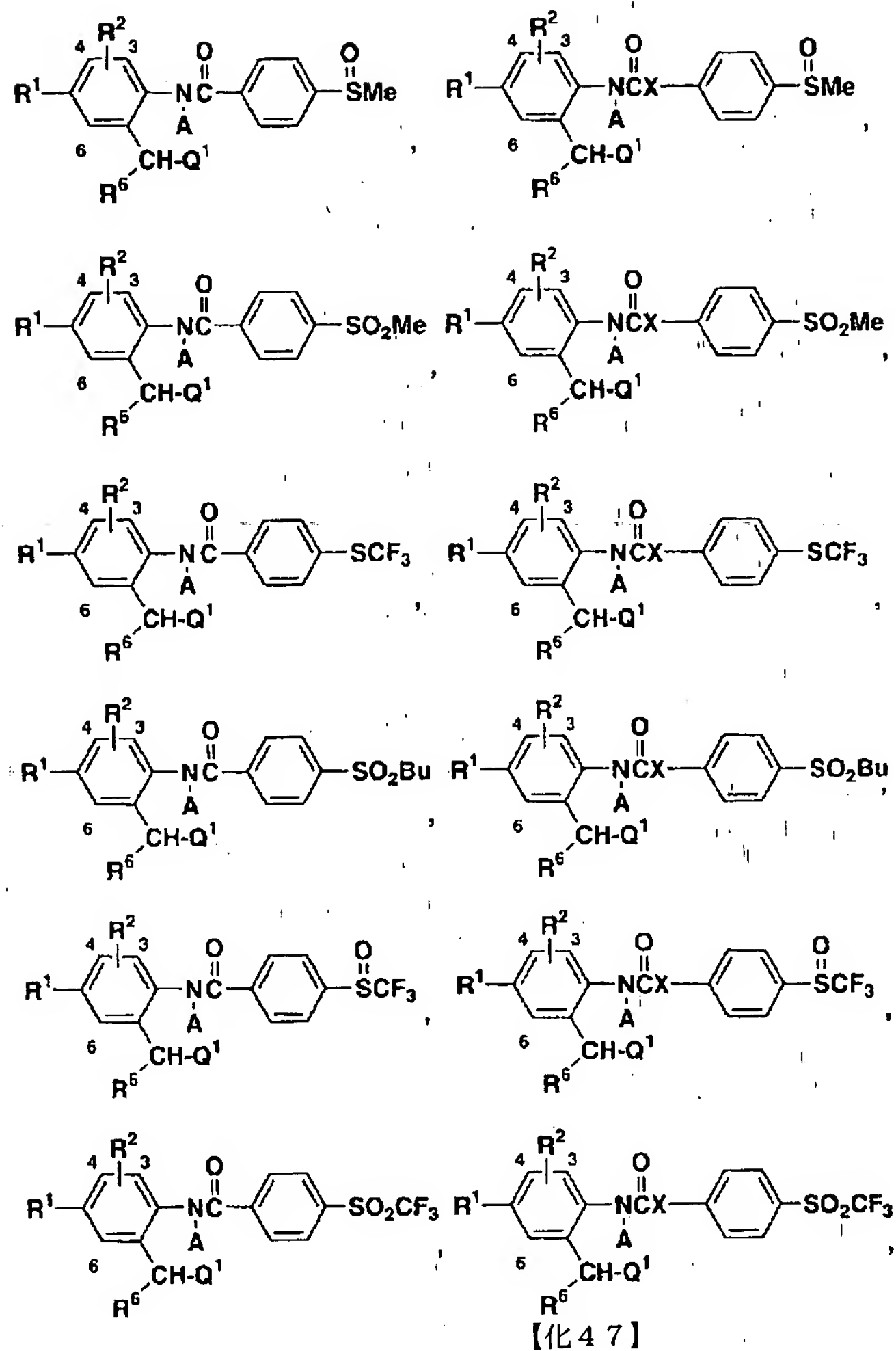
【0111】

【化45】



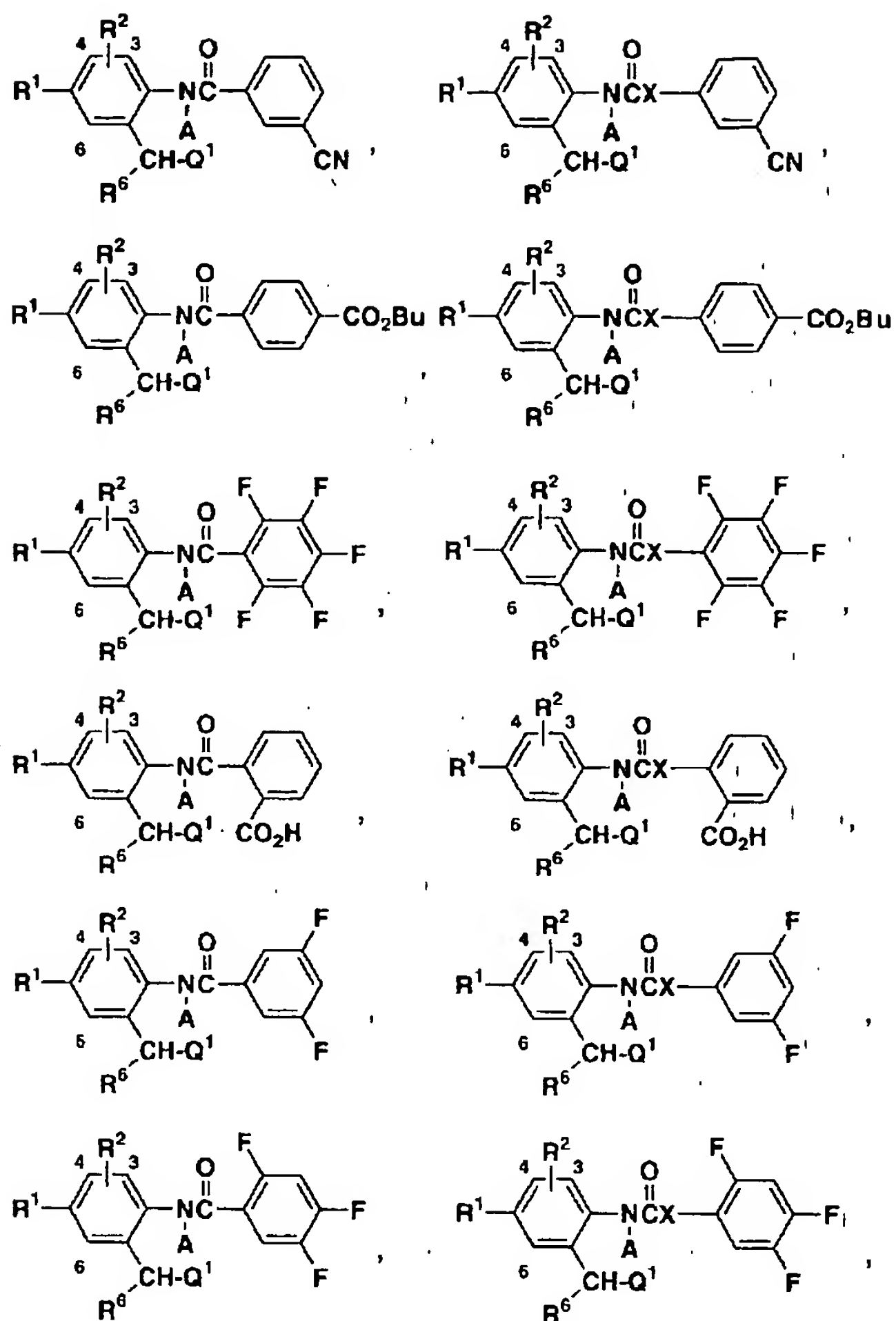
【0112】

【化46】



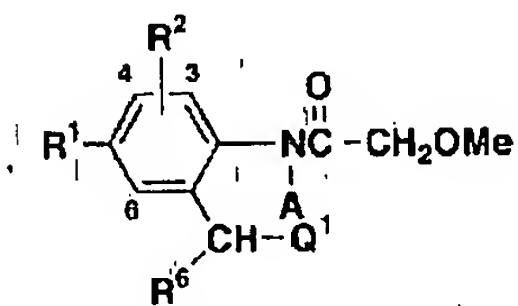
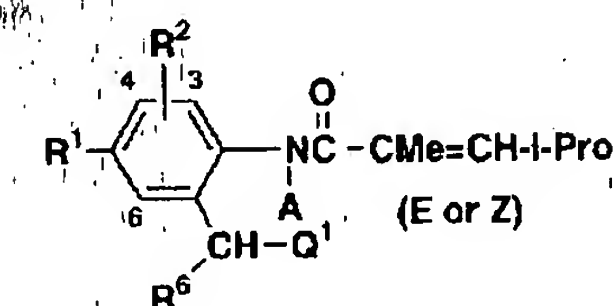
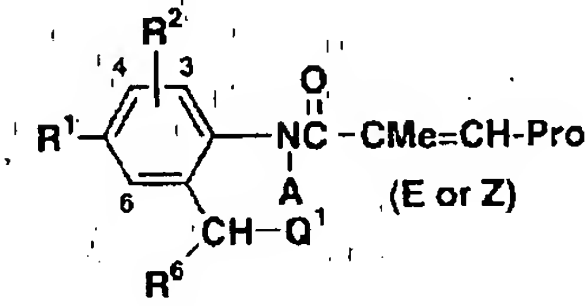
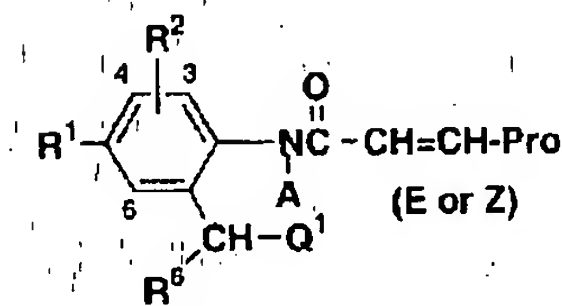
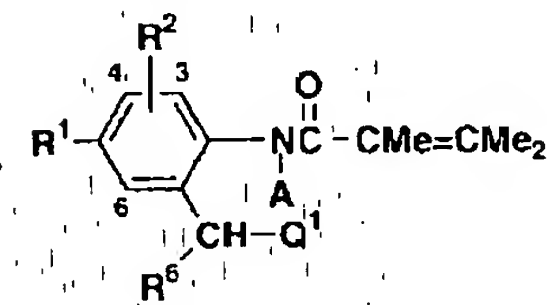
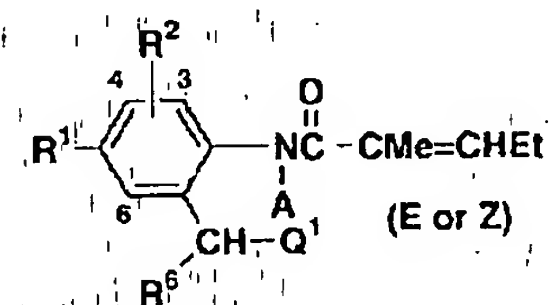
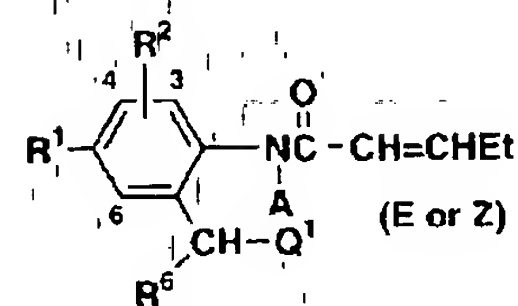
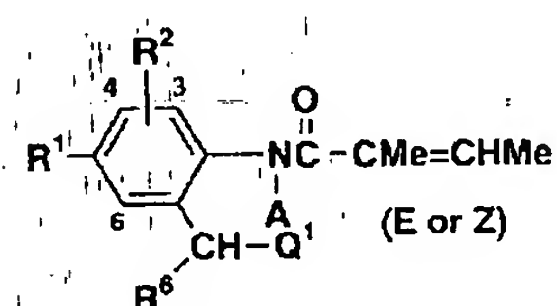
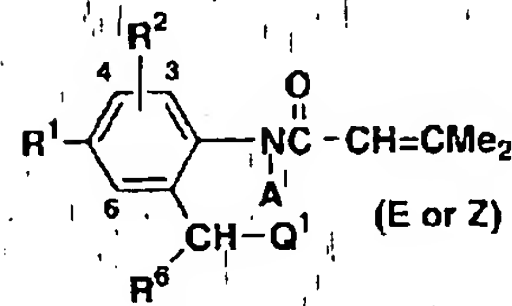
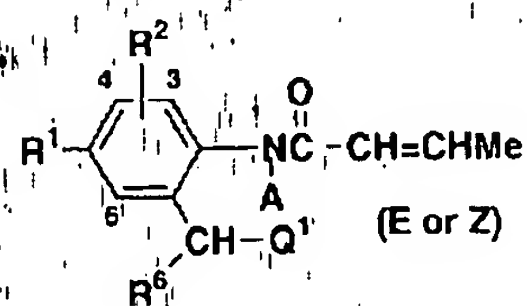
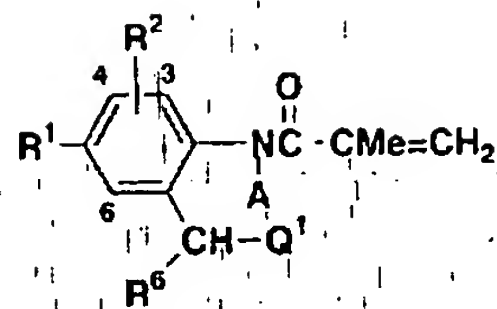
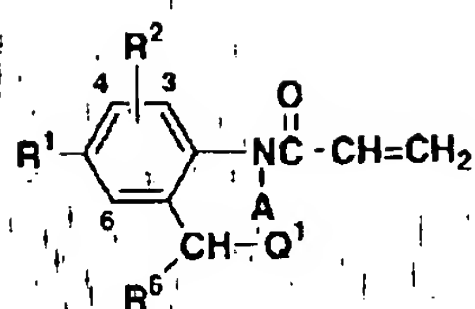
【0113】

【化47】



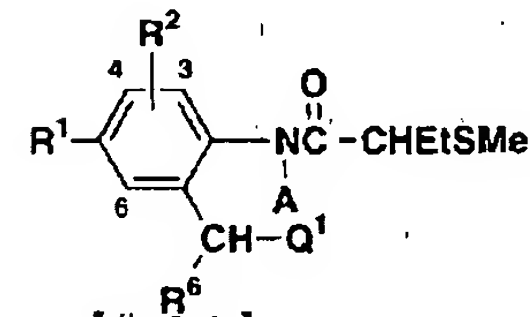
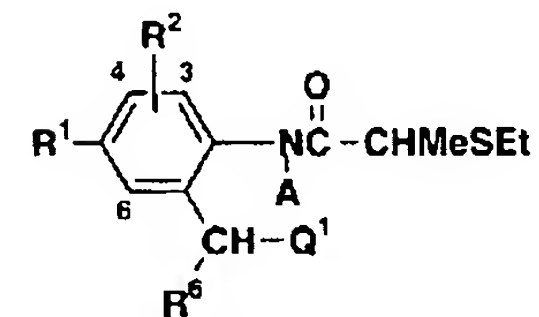
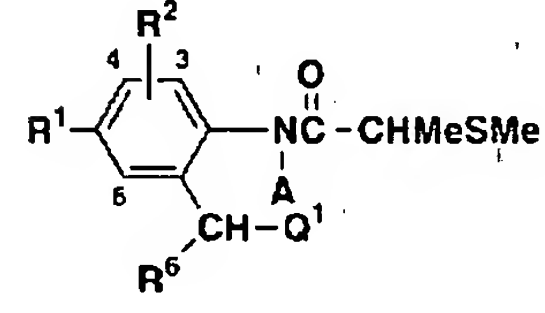
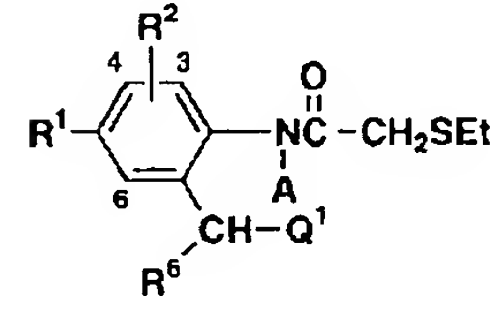
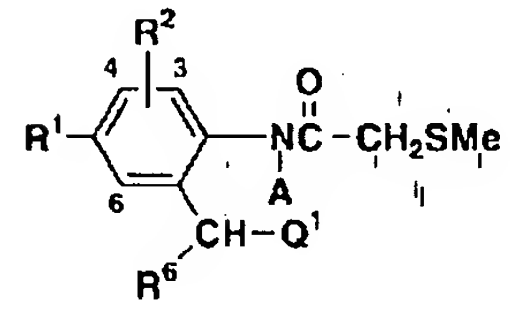
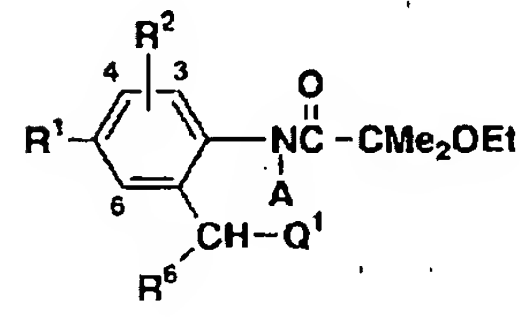
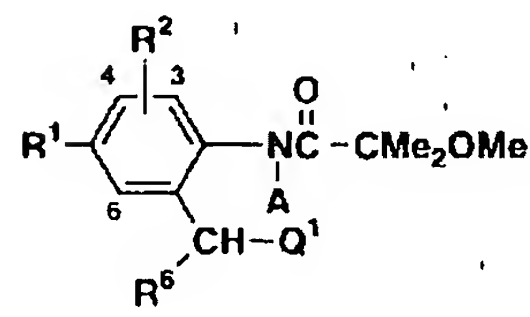
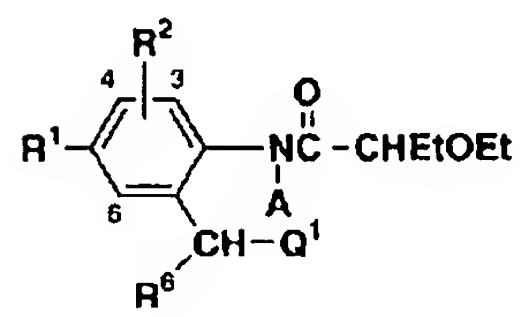
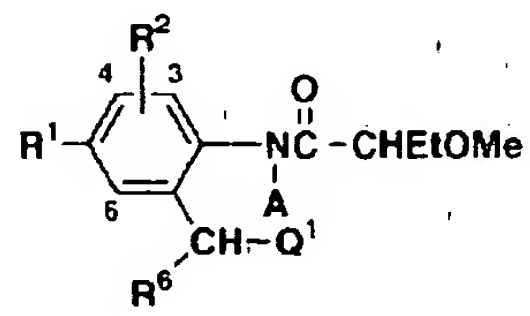
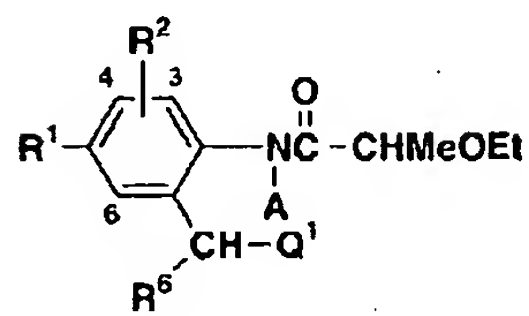
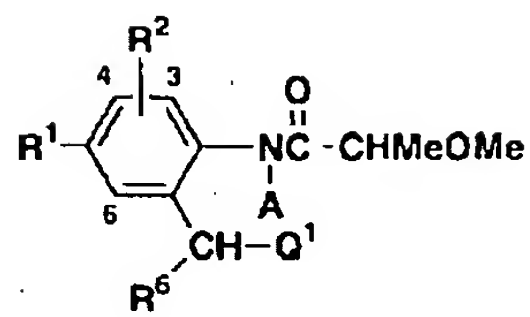
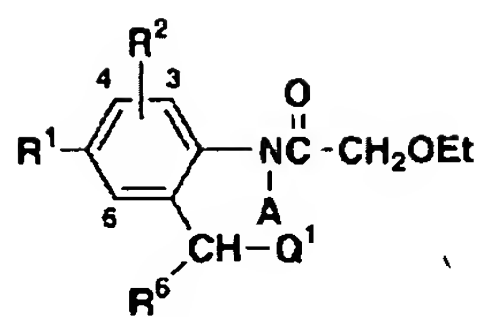
【0114】

【化48】



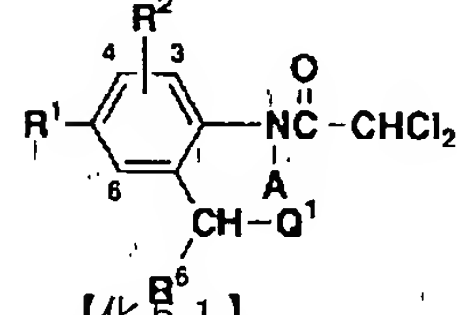
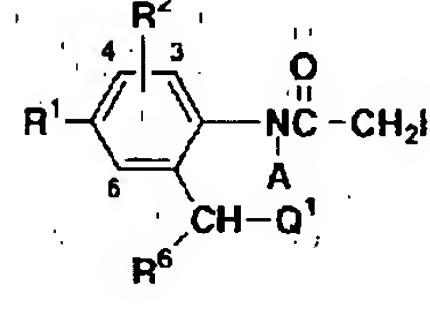
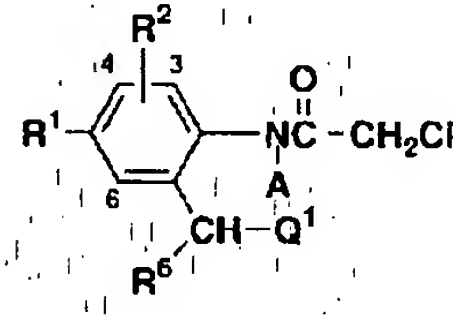
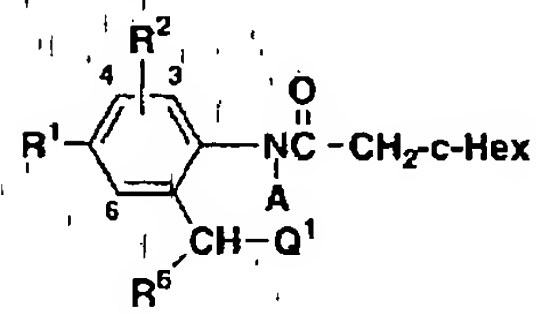
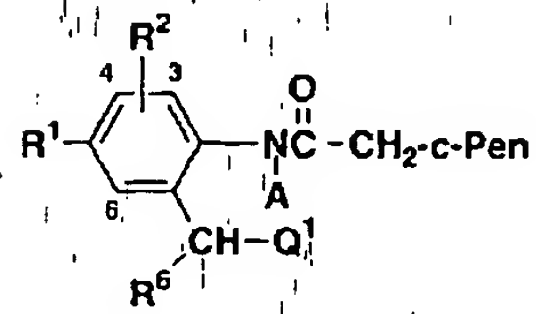
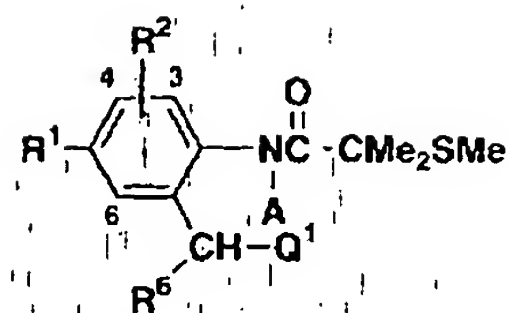
[0115]

[化49]

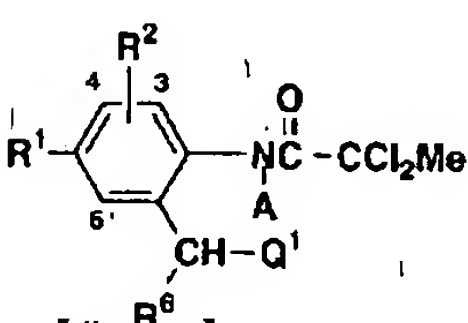
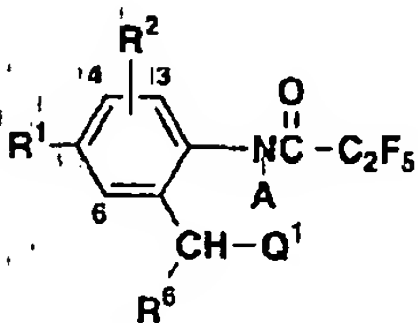
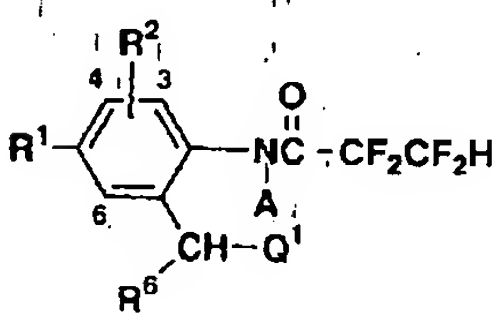
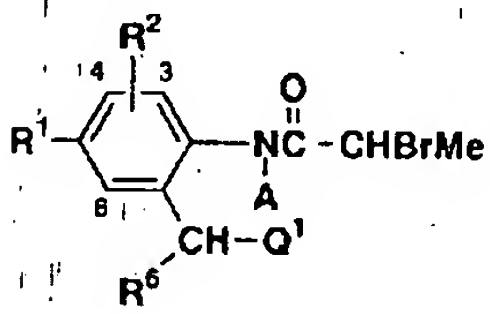
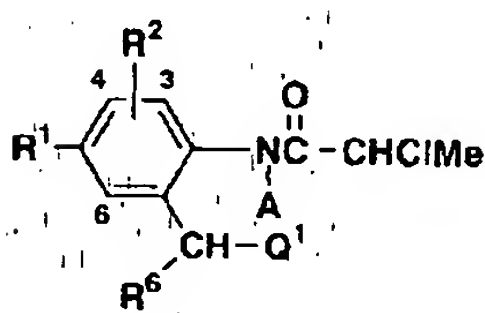
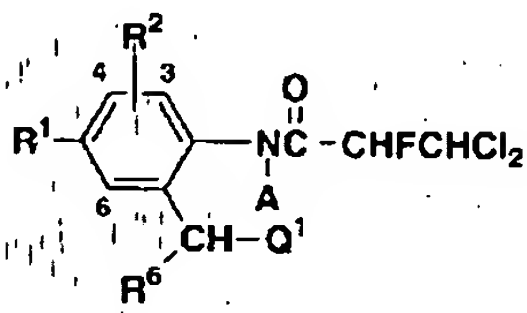
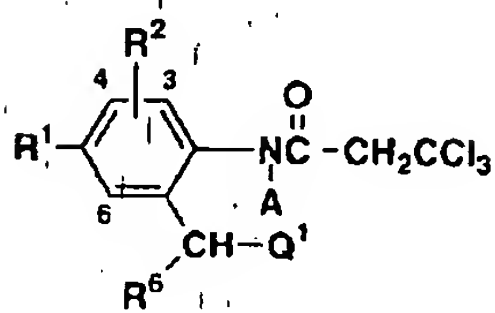
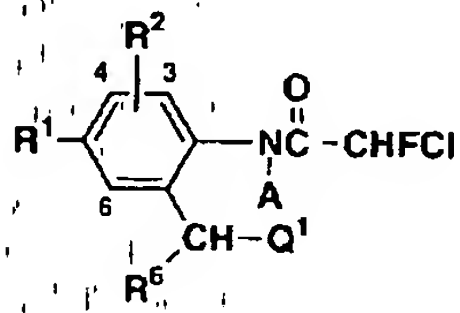
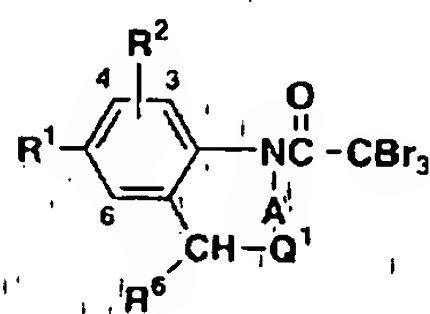
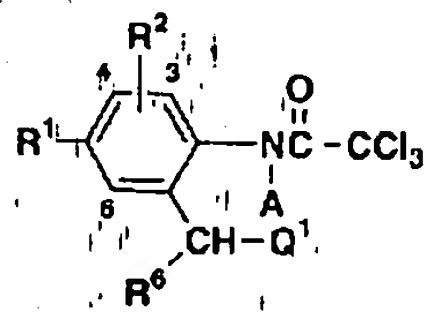
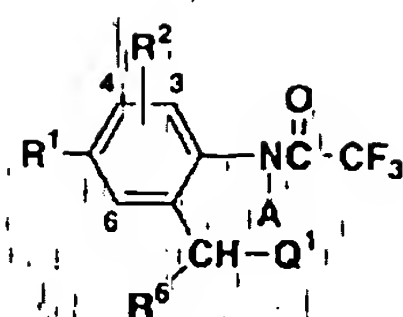
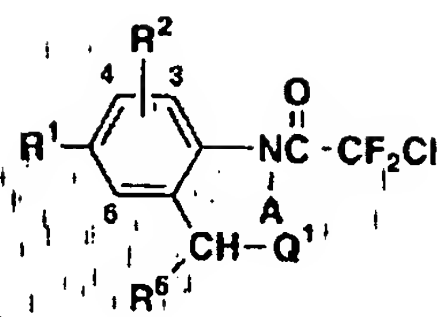


【0116】

【化50】

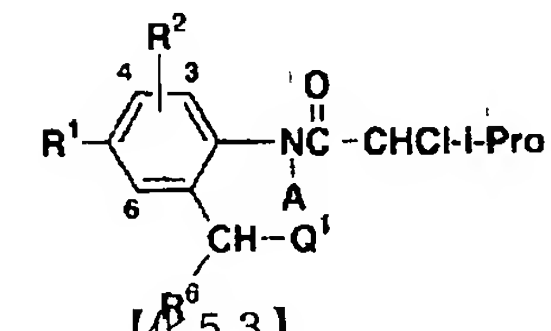
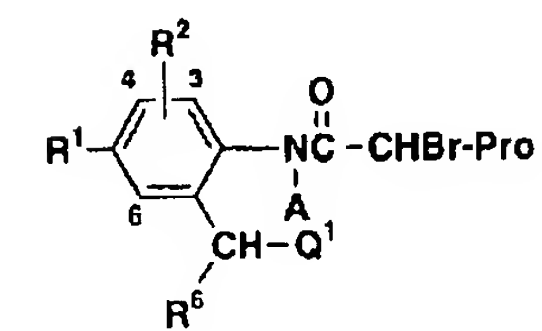
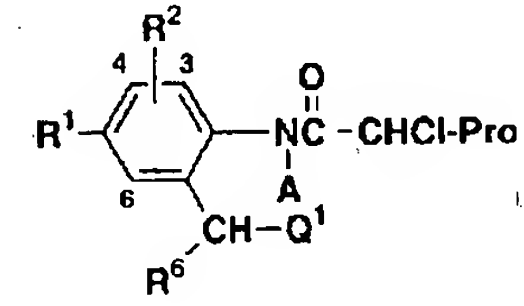
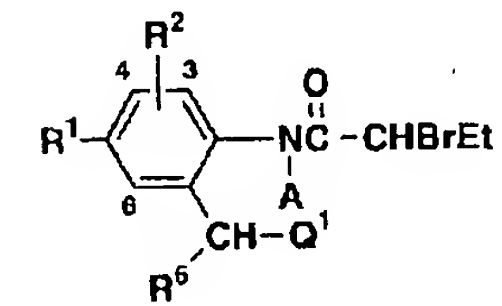
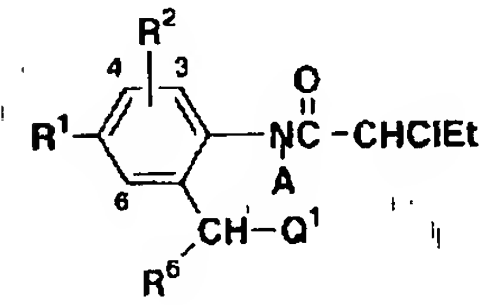
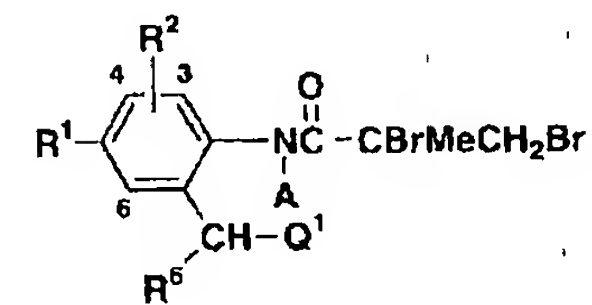
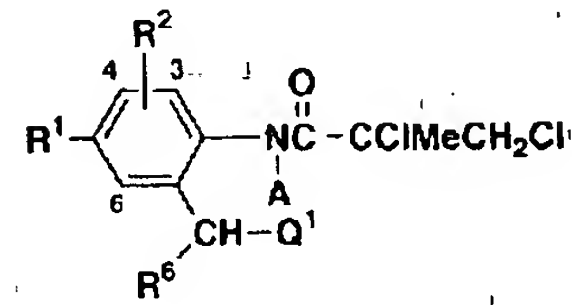
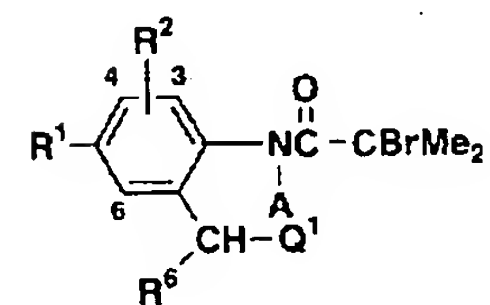
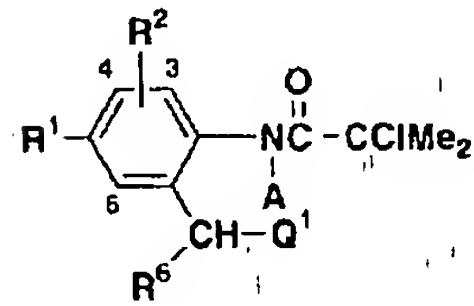
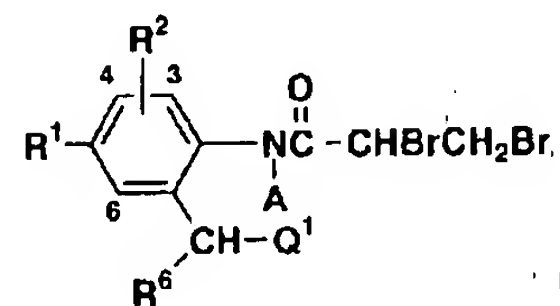
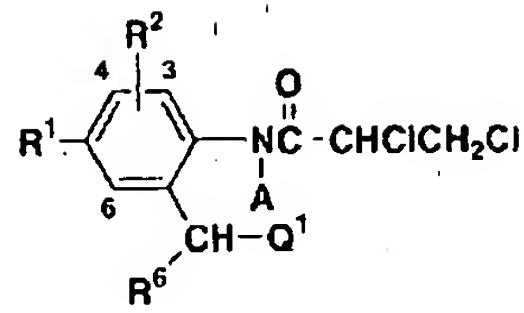
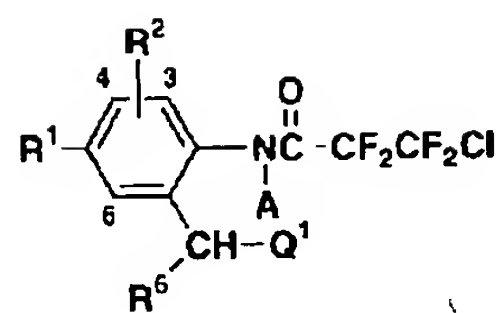


【化 5 1】



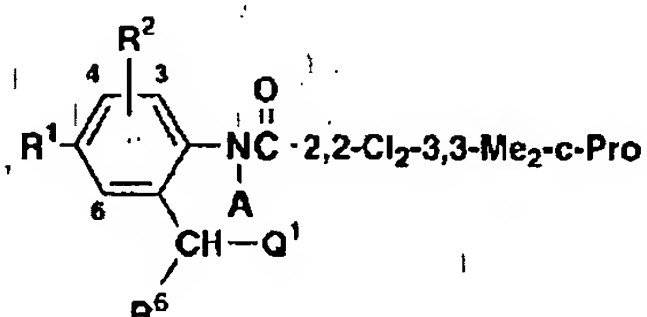
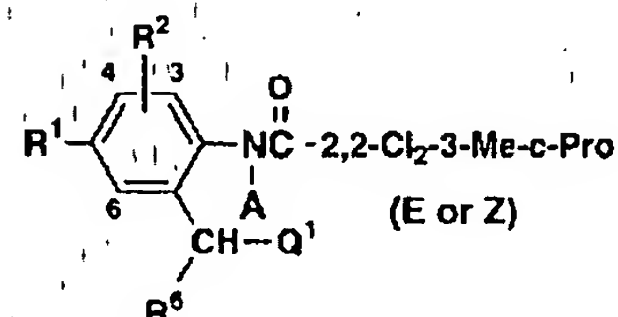
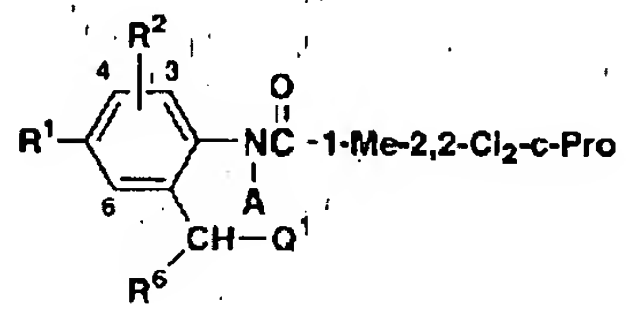
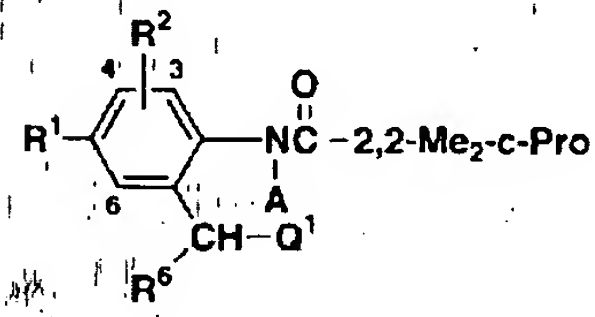
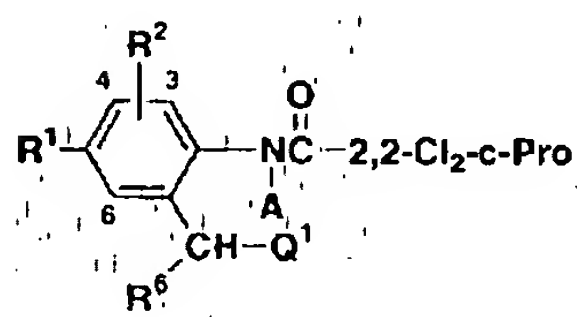
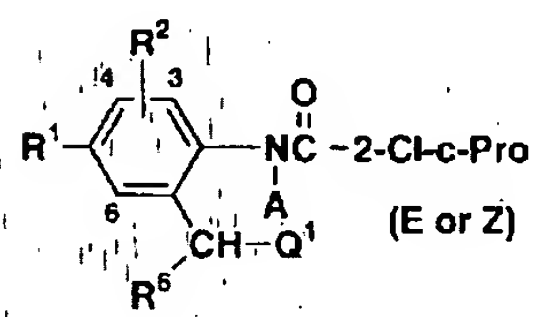
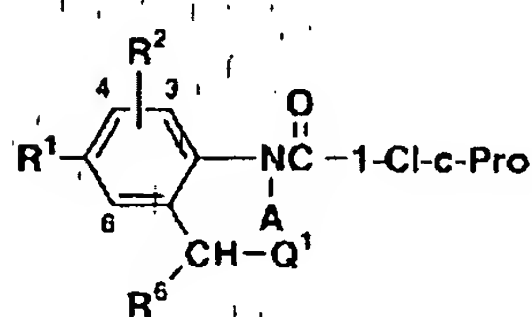
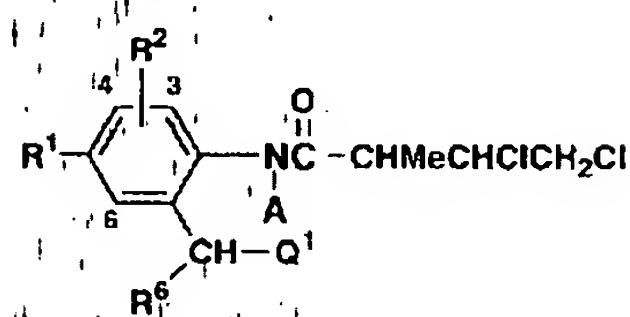
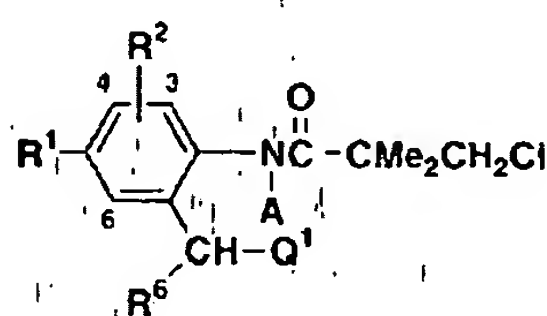
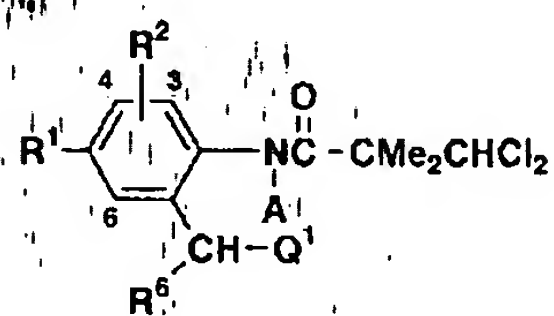
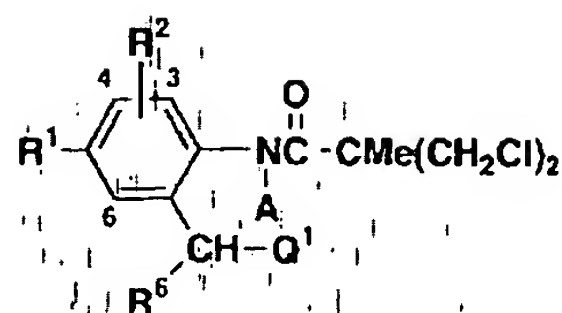
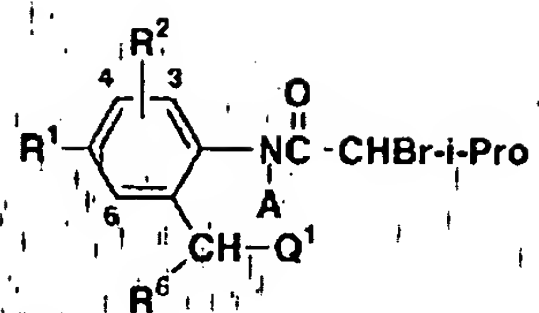
[0118]

[化52]



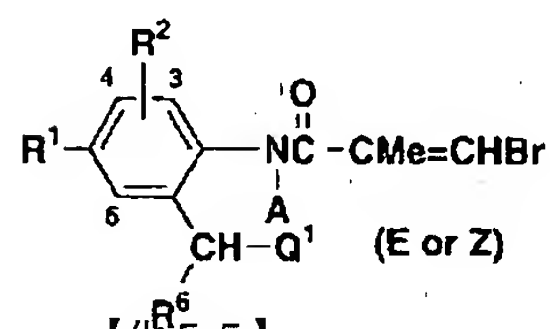
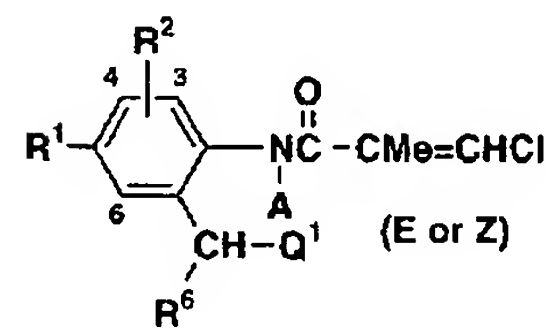
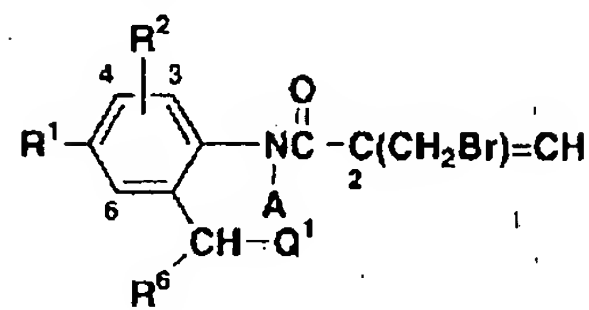
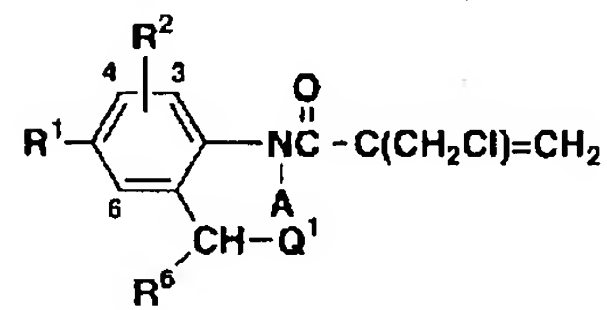
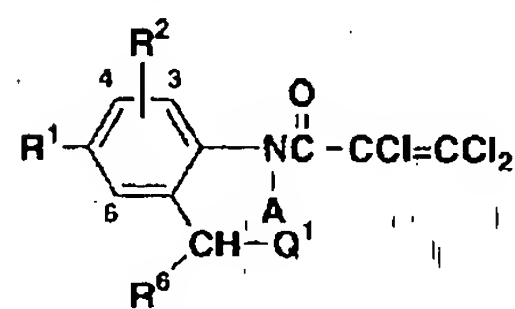
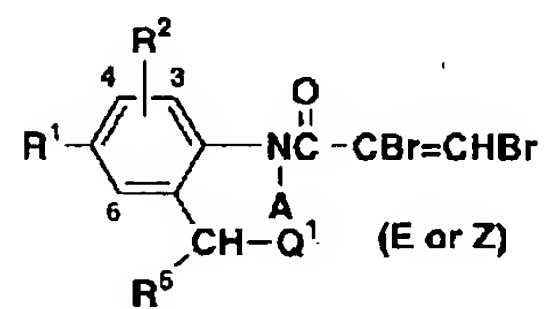
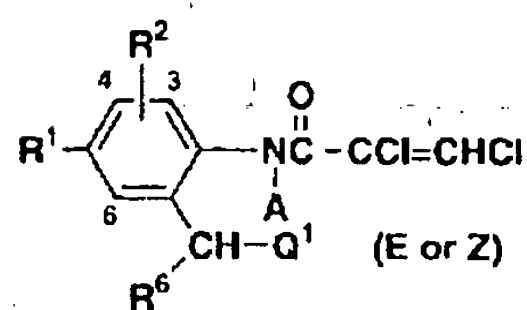
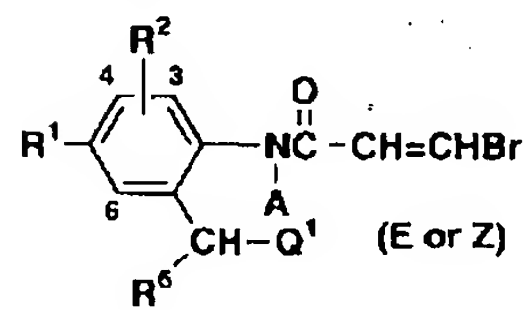
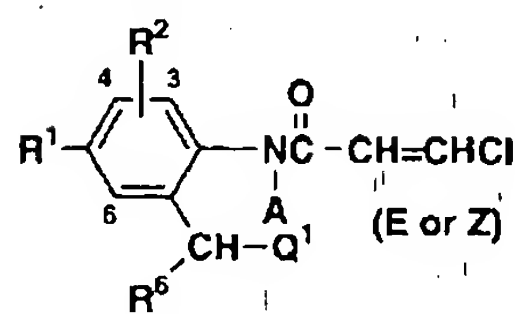
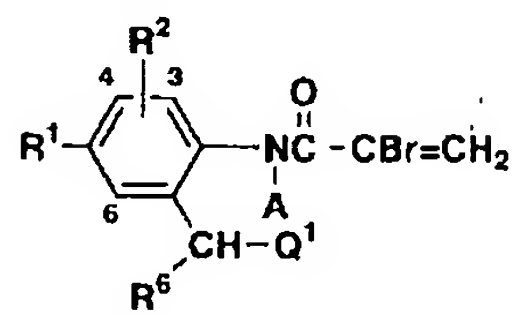
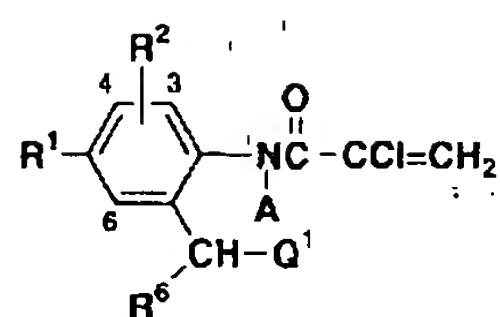
【0119】

【153】

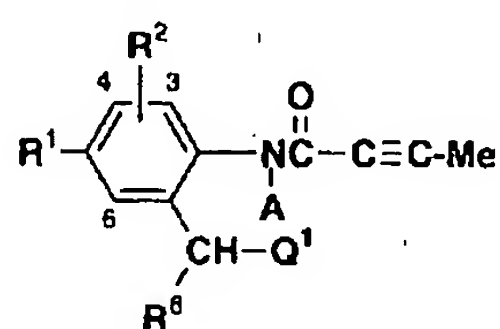
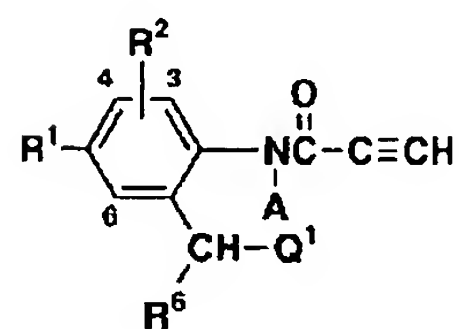
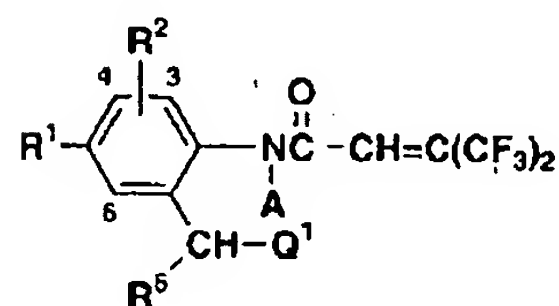
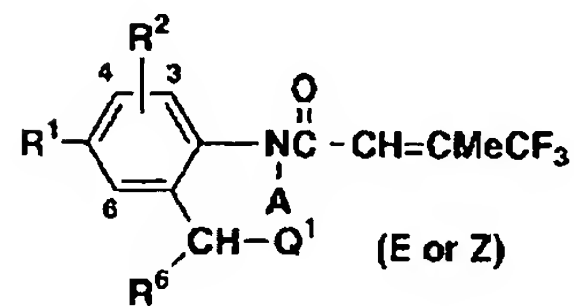
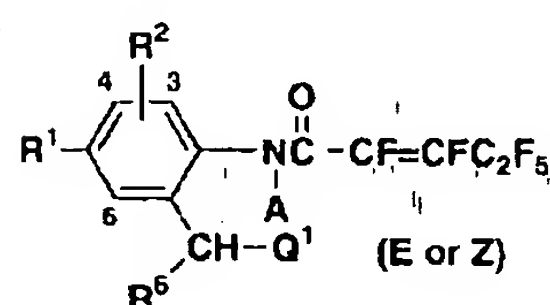
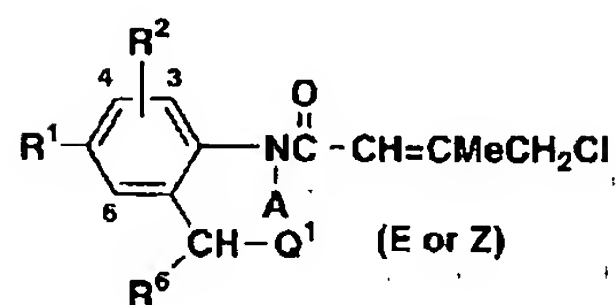
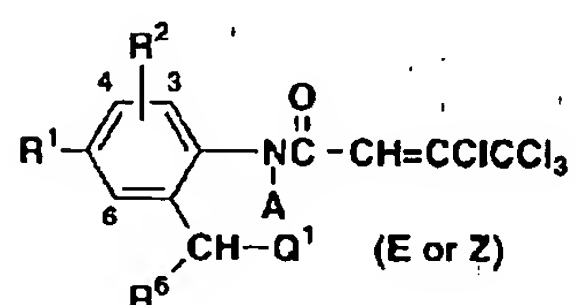
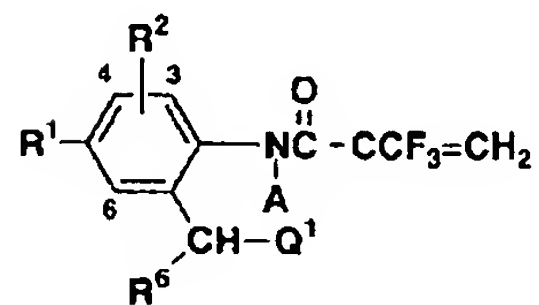
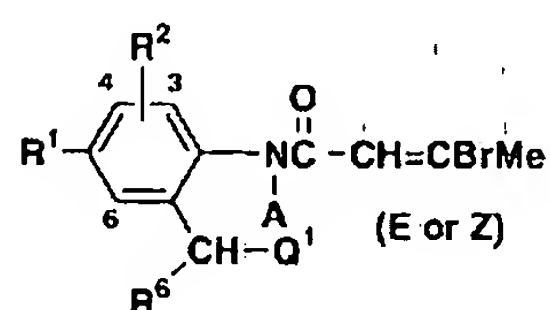
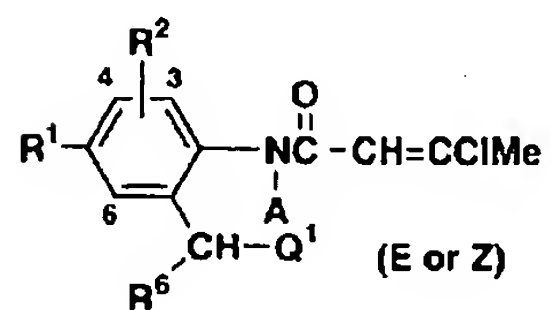
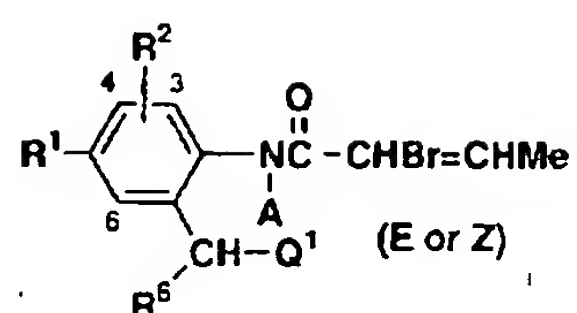
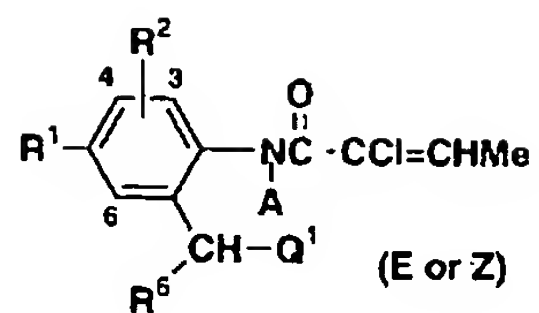


【0120】

【化54】

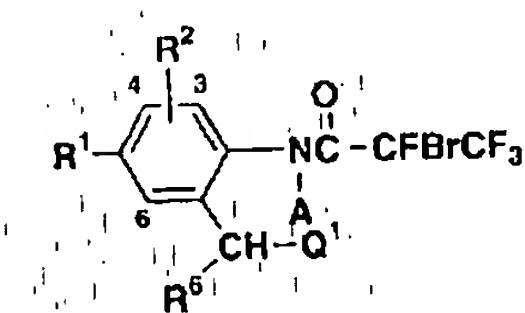
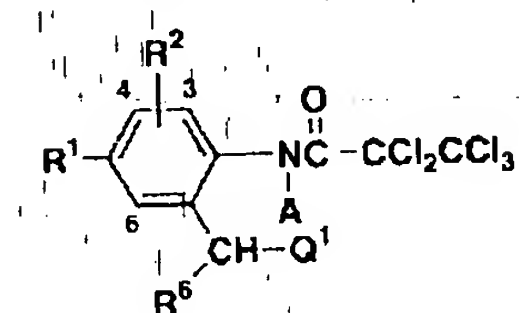
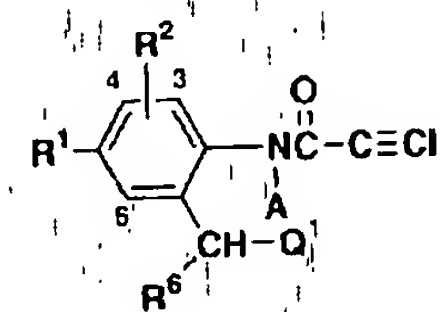
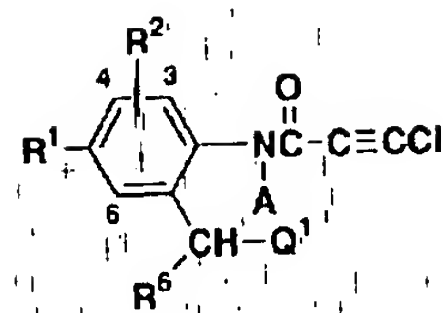
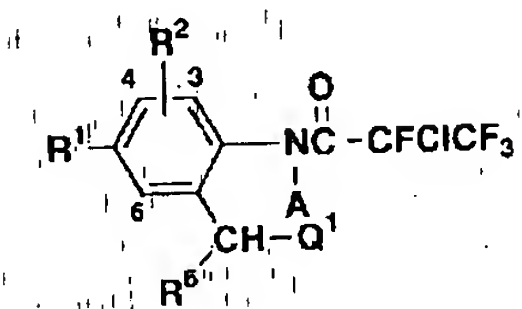
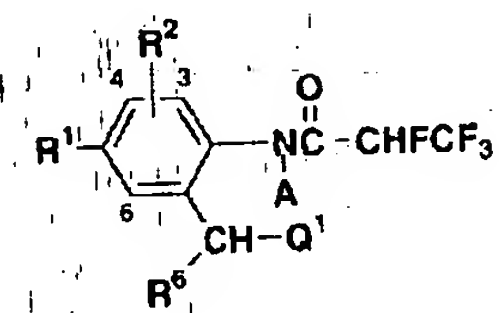
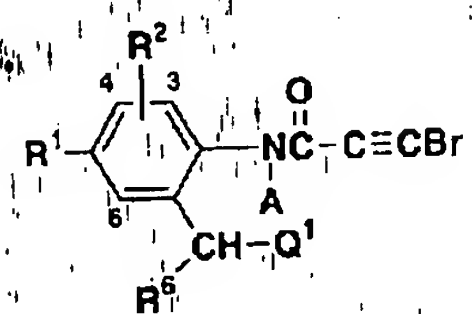
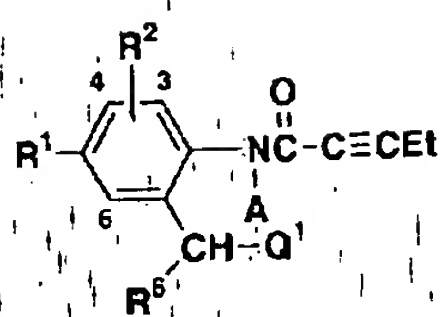


【化55】



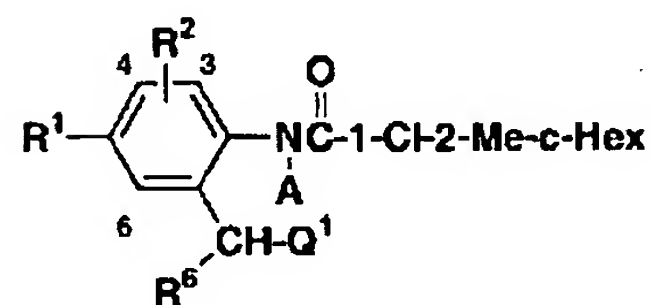
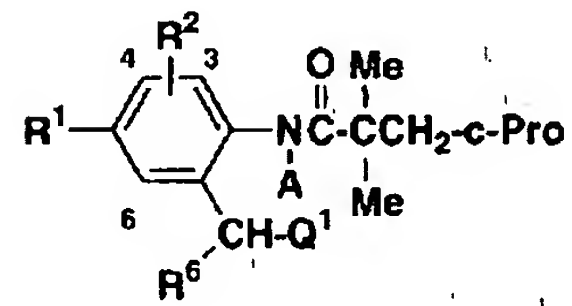
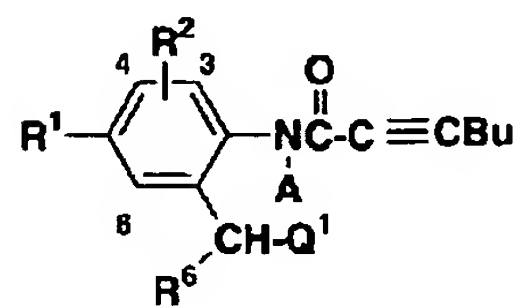
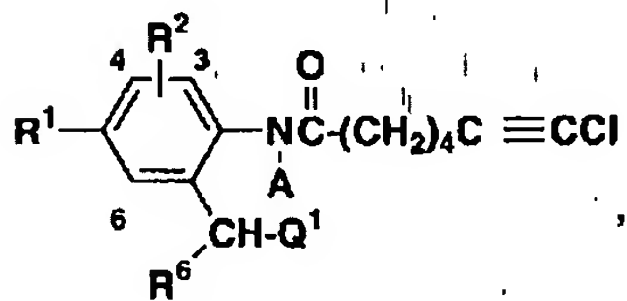
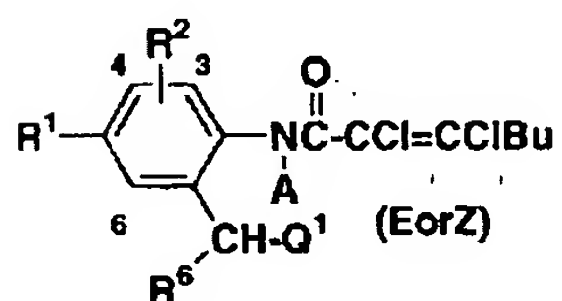
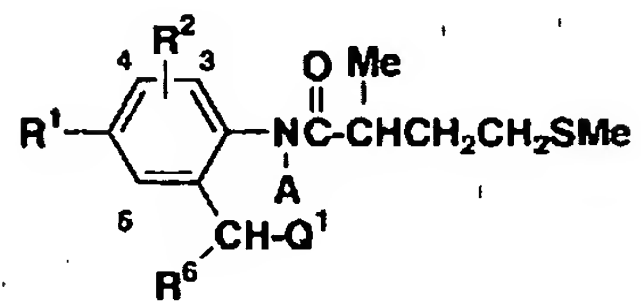
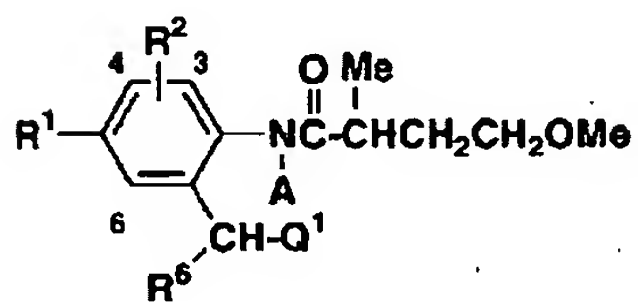
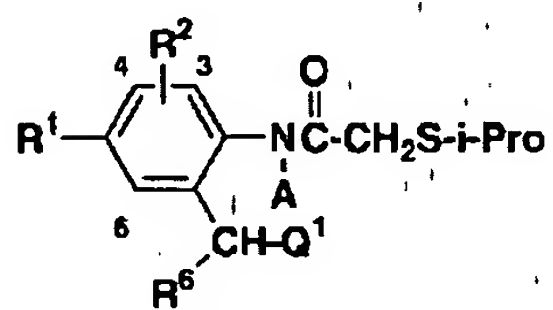
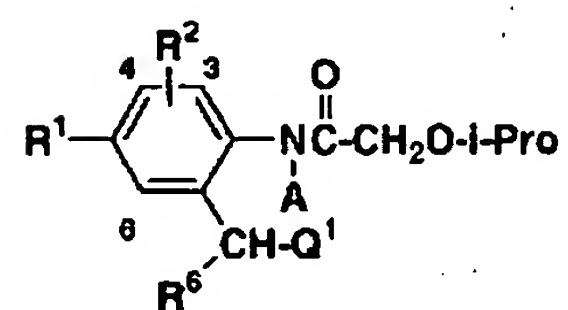
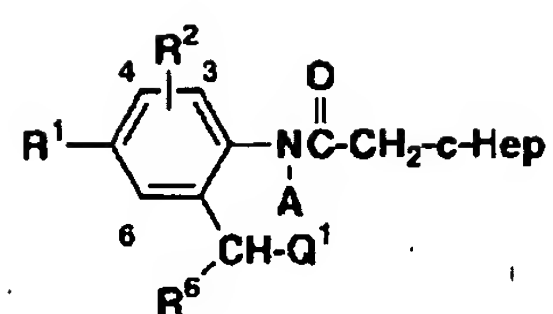
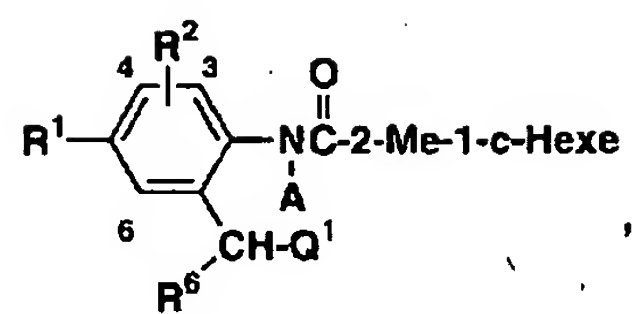
【0122】

【化56】



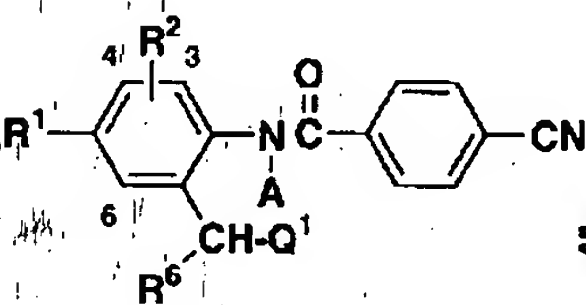
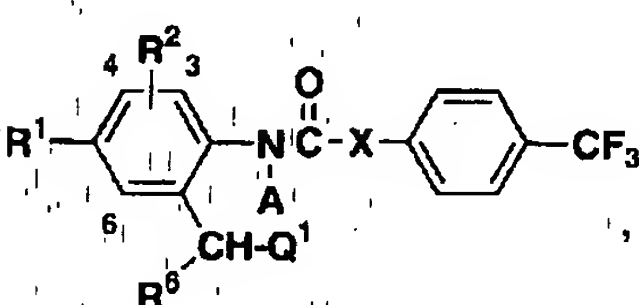
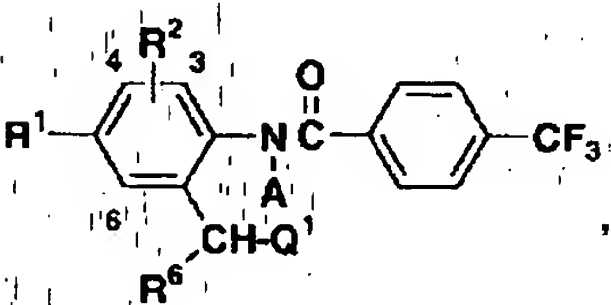
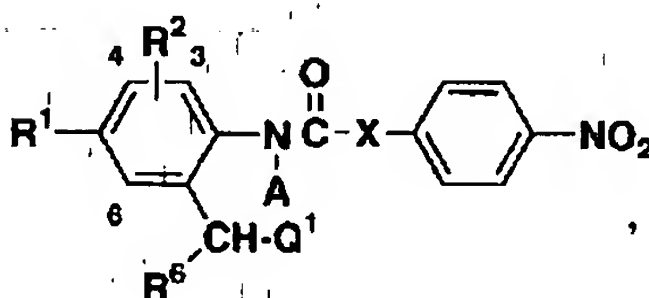
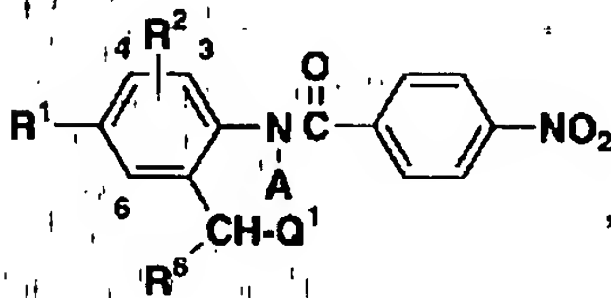
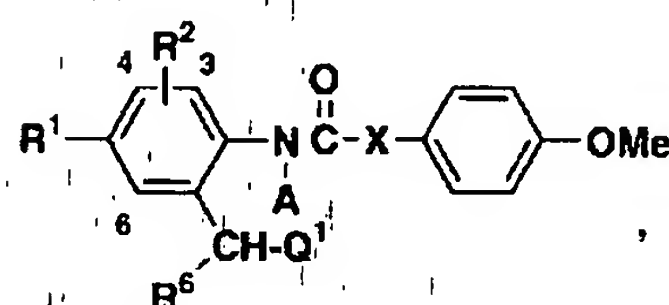
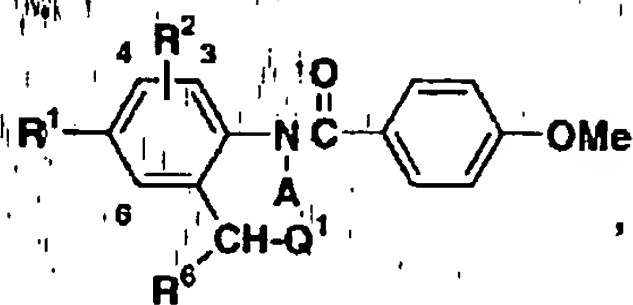
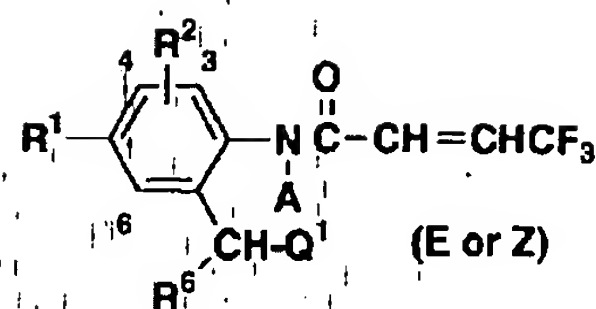
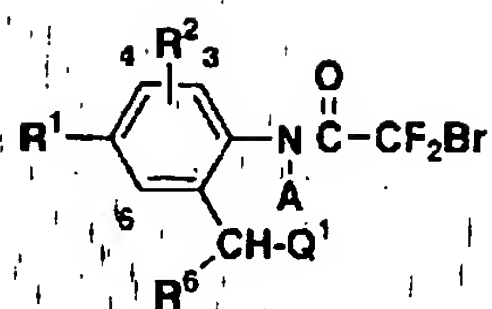
[化57]

[0123]

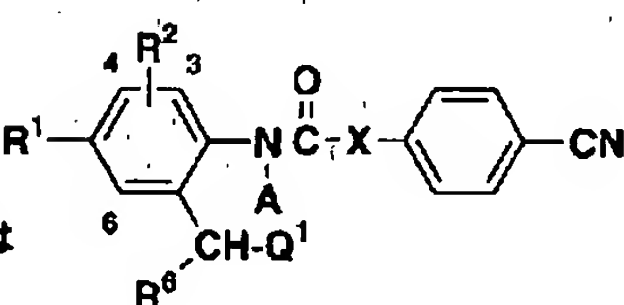


【0124】

【化58】



または



【0125】但し、AはH、CHO、MeCO、EtCO、ProCO、i-
-ProCO、BuCO、i-BuCO、s-BuCO、t-BuCO、CF₃CO、CF₂Cl
CO、CCl₃CO、CHCl₂CO、C₂F₅CO、CF₃CH₂CO、MeCHClCO、C
HF₂CF₂CO、CF₂ClCF₂CO、EtCHClCO、i-ProCHBrCO、CO₂M
e、CO₂Et、CO₂Pro、CO₂i-Pro、CO₂Bu、CO₂t-Bu、CO₂CH₂
CF₃、CO₂CH(CF₃)₂、CO₂(CH₂)₄Cl、CH₂=CHCO、CH₂=CMeC
O、MeCH=CHCO(E or Z)、Me₂C=CHCO、C(O)SMe、C(O)SEt、C
(O)SBu、c-ProCO、1-Me-c-ProCO、2-Me-c-ProCO、c-BuCO、
c-PenCO、c-HexCO、CO₂c-Pro、CO₂c-Pen、CO₂c-He

x、MeS、EtS、BuS、MeSO、EtSO、BuSO、MeSO₂、EtSO₂、
ProSO₂、BuSO₂、CCl₃S、CF₃S、CF₂ClS、C₂F₅S、CF₃(C
F₂)₃S、CCl₃SO₂、CF₃SO₂、CF₂ClSO₂、C₂F₅SO₂、CF₃(CF
F₂)₃SO₂を示し、XはO、S、NH、MeN、EtN、ProNまたはis
o-ProNを示す。

【0126】

【表23】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
Me	H	H	3-Cl-Q-2
Me	H	H	3,5-Cl ₂ -Q-2
Me	H	H	3-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	H	3,4-Cl ₂ -Q-2
Me	H	H	3,5-Cl ₂ -Q-2
Me	H	H	3,5-Cl ₂ -4-CO ₂ Me-Q-2
Me	H	H	3-Br-Q-2
Me	H	H	4-Cl-Q-2
Me	H	H	3-Me-4-Cl-Q-2
Me	H	H	3-i-Pro-5-Cl-Q-2

Me	H	H	3-t-Bu-5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CN-Q-2
Me	H	H	3-CN-5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CN-5-Me-Q-2
Me	H	H	3-CN-4-Cl-Q-2
Me	H	H	4-CN-Q-2
Me	H	H	3-Cl-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	H	3-CCl ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CCl ₃ -5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CCl ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-CCl ₃ -5-Et-Q-2
Me	H	H	3-CF ₂ Cl-Q-2
Me	H	H	3-CF ₂ Cl-5-Cl-Q-2

【0127】

【表24】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
Me	H	H	3-CF ₂ Cl-5-Me-Q-2
Me	H	H	3-CF ₂ Cl-5-Et-Q-2
Me	H	H	3-CF ₂ Cl-5-F-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -5-Et-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -5-F-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-NO ₂ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-Me-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -5-OMe-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4,5-Me ₂ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-CO ₂ Me-5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -5-Br-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-Br-Q-2
Me	H	H	3,5-(CF ₃) ₂ -Q-2
Me	H	H	3-C ₂ F ₅ -Q-2
Me	H	H	3-C ₂ F ₅ -5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-C ₂ F ₅ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-C ₂ F ₅ -5-Et-Q-2
Me	H	H	3-C ₂ F ₅ -5-F-Q-2

【0128】

【表25】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
Me	H	H	3-C ₂ F ₅ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	H	3-C ₂ F ₅ -4-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ CH ₂ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ CH ₂ -5-Cl-Q-2

Me	H	H	3-CF ₃ CH ₂ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ CH ₂ -5-Et-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ CH ₂ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	H	3-OCF ₃ -Q-2
Me	H	H	3-OCF ₃ -5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-OCF ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-OCF ₃ -5-Et-Q-2
Me	H	H	3-OCF ₃ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	H	3-OCHF ₂ -Q-2
Me	H	H	3-OCHF ₂ -5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-OCHF ₂ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-OCHF ₂ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	H	3-C ₃ F ₇ -Q-2
Me	H	H	3-C ₃ F ₇ -5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-C ₃ F ₇ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-Me-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	H	3,5-Me ₂ -4-NO ₂ -Q-2
Me	H	H	3-i-Pro-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	H	3-i-Pro-4-Cl-Q-2

【0129】

【表26】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
Me	H	H	3-t-Bu-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	H	3-t-Bu-4-Cl-Q-2
Me	3-Cl	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-Cl	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	3-Me	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-Me	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	3-NO ₂	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-NO ₂	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	3-OMe	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-OMe	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	4-NO ₂	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	4-NO ₂	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Cl	H	H	3-CF ₃ -Q-2
Cl	H	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
Cl	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Et	H	H	3-CF ₃ -Q-2
Et	H	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
Et	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
OMe	H	H	3-CF ₃ -Q-2
OMe	H	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
OMe	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
SMe	H	H	3-CF ₃ -Q-2
SMe	H	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2

【0130】

【表27】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
SMe	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-3(R ⁴ :H)
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-3(R ⁴ :Me)
Me	H	H	5-CF ₃ -4-Cl-Q-3(R ⁴ :Me)
Me	H	H	5-CF ₃ -4-Me-Q-3(R ⁴ :Me)
Cl	H	H	5-CF ₃ -Q-3(R ⁴ :Me)
Me	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-4(R ⁴ :Me)
Me	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-4(R ⁴ :H)
Me	H	H	3-Me-5-CF ₃ -Q-4(R ⁴ :Me)
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :H)
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
Cl	H	H	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-15
Me	H	H	5-CF ₃ -4-Me-Q-15
Cl	H	H	5-CF ₃ -Q-15
Me	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-16
Me	H	H	3-Me-5-CF ₃ -Q-16
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-17
Me	H	H	3-CF ₃ -4-Me-Q-17
Cl	H	H	3-CF ₃ -Q-17
Cl	H	Me	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-Cl-Q-1
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-1

【0131】

【表28】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
Me	H	H	3-NO ₂ -Q-1
Me	H	H	4-CF ₃ -Q-6
Me	H	H	2-Me-4-CF ₃ -Q-6
Me	H	H	2-Cl-4-CF ₃ -Q-6
Me	H	H	4-CF ₃ -Q-7(R ⁴ :H)
Me	H	H	4-CF ₃ -Q-7(R ⁴ :Me)
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-7(R ⁴ :Me)
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-8(R ⁴ :H)
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-8(R ⁴ :Me)
Me	H	H	2-CF ₃ -5-Me-Q-8(R ⁴ :H)
Me	H	H	2-CF ₃ -5-Me-Q-8(R ⁴ :Me)
Me	H	H	2-CF ₃ -5-Cl-Q-8(R ⁴ :H)
Me	H	H	2-CF ₃ -5-Cl-Q-8(R ⁴ :Me)
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-9(R ⁴ :H)
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-9(R ⁴ :Me)
Me	H	H	2-CF ₃ -4-Me-Q-9(R ⁴ :H)
Me	H	H	2-CF ₃ -4-Me-Q-9(R ⁴ :Me)
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-10
Me	H	H	2-CF ₃ -5-SMe-Q-10
Me	H	H	2-CF ₃ -5-SO ₂ Me-Q-10

Me	H	H	2,5-Cl ₂ -Q-10
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-11(R ⁴ :H)
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-11(R ⁴ :Me)

【0132】

【表29】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
Me	H	H	5-Cl-Q-11(R ⁴ :H)
Me	H	H	5-Cl-Q-11(R ⁴ :Me)
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-12
Me	H	H	3-CF ₃ -4-Me-Q-12
Me	H	H	3-CF ₃ -4-Cl-Q-12
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-13(R ⁴ :H)
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-13(R ⁴ :Me)
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-14(R ⁴ :Me)
Me	H	H	4-CF ₃ -Q-18
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-18
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-19
Me	H	H	2-CF ₃ -5-Me-Q-19
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-20
Me	H	H	2-CF ₃ -4-Me-Q-20
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-21
Me	H	H	5-Cl-Q-21
Me	H	H	4-CF ₃ -Q-22
Me	H	H	4-Cl-Q-22
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-23
Me	H	H	2-C ₂ F ₅ -Q-23
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-24
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-25
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-26

【0133】

【表30】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
Me	H	H	4-CF ₃ -Q-27
Me	H	H	4-CF ₃ -5-Cl-Q-27
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-27
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-28
Me	H	H	2-CF ₃ -5-Cl-Q-28
Me	H	H	2-CF ₃ -4-Me-Q-29
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-29
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-30
Me	H	H	5-Cl-Q-30
Me	H	H	5-C ₂ F ₅ -Q-30
Me	H	H	4-CF ₃ -Q-31
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-32
t-Bu	H	H	3-CF ₃ -Q-2
CF ₃	H	H	3-CF ₃ -Q-12

OBu	H	H	4-CF ₃ -Q-18
OCHF ₂	H	H	3-CN-Q-2
SBu	H	H	3-CF ₃ -Q-2
MeOCH ₂	H	H	2-CF ₃ -Q-19
EtOCH ₂	H	H	5-CF ₃ -Q-24
MeO(CH ₂) ₂	H	H	4-CF ₃ -Q-27
MeSCH ₂	H	H	4-CF ₃ -Q-31
MeCO	H	H	3-CF ₃ -Q-2
F	H	H	3-CF ₃ -Q-2

【0134】

【表31】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
F	F	H	3-C ₂ F ₅ -Q-2
Br	H	H	3-CHF ₂ -Q-2
NO ₂	H	H	3-CF ₃ -Q-2
CN	H	H	4-Cl-Q-2
Me	3-Pro	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-CF ₃	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	4-O-i-Pro	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	4-OCF ₃	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-Br	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-CN	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	H	Et	3-CF ₃ -Q-2
Me	H	i-Pro	3-CF ₃ -Q-2
Me	H	Bu	3-CF ₃ -Q-2
CN	H	H	3-CF ₃ -Q-2
CN	H	H	3-C ₂ F ₅ -Q-2
CN	H	H	3-Cl-Q-2
CN	H	H	3-CN-Q-2
CN	H	H	3-Br-Q-2
CN	H	H	3-OCF ₃ -Q-2
CN	H	H	3-CF ₃ (CF ₂) ₂ -Q-2
CN	H	H	3-CF ₃ (CF ₂) ₃ -Q-2
CN	H	H	3-OCH ₂ CF ₃ -Q-2
CN	H	H	3-CF ₃ -5-CH ₃ -Q-2

【0135】

【表32】

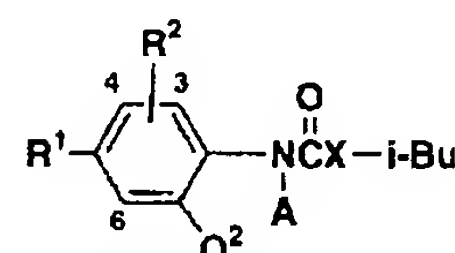
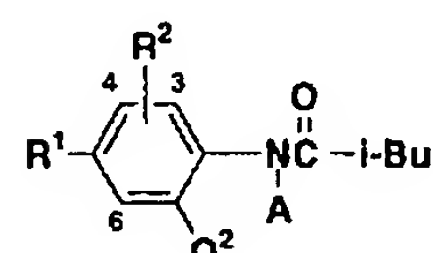
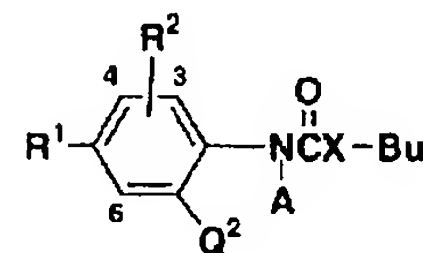
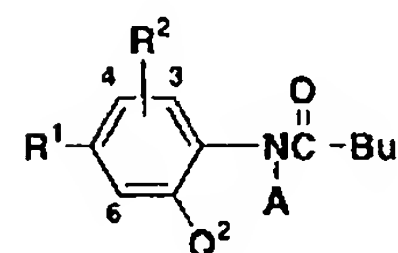
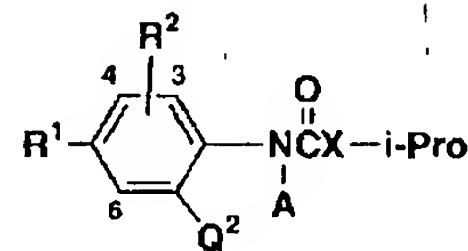
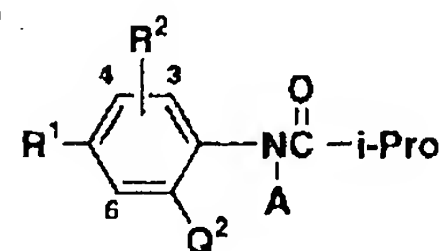
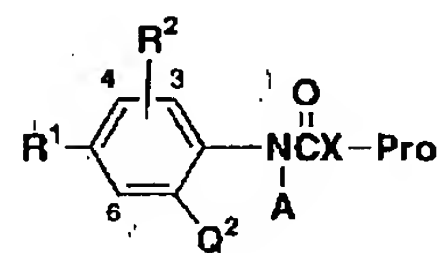
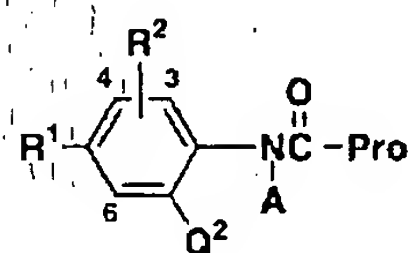
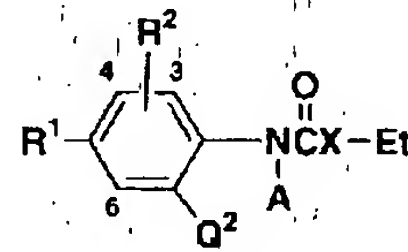
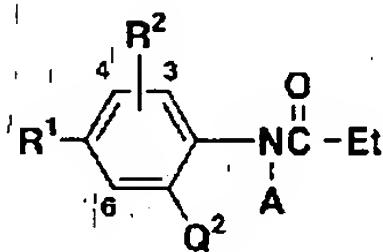
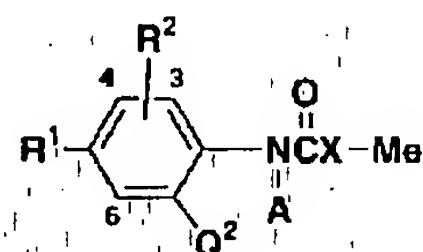
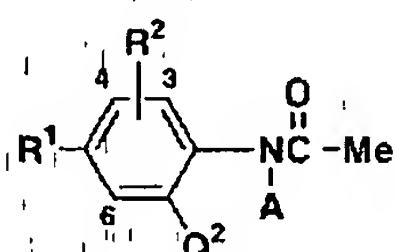
R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
CN	H	H	3-i-Pr-5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CN-5-CH ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CN-5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CN-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ (CF ₂) ₂ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-CO ₂ Bu-Q-2
Me	H	H	3,5-(C ₂ F ₅) ₂ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ (CF ₂) ₂ -4-Cl-Q-2

Me	H	H	3-CF ₃ -5-OBu-Q-2
Me	H	H	4-Cl-5-OCH ₂ CF ₃ -Q-2
Me	H	H	2-CF ₃ -5-SBu-Q-10
Me	H	H	2-CF ₃ -5-SO ₂ Bu-Q-10
Me	H	H	2-CF ₃ -5-SOMe-Q-10
Me	H	H	2-CF ₃ -5-SOBu-Q-10
Me	H	H	3-CF ₃ -4-SCF ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-SOCF ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-SO ₂ CF ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-S(CF ₂) ₃ CF ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-SO(CF ₂) ₃ CF ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-SO ₂ (CF ₂) ₃ CF ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-CO ₂ H-Q-2

【0136】 [表4]

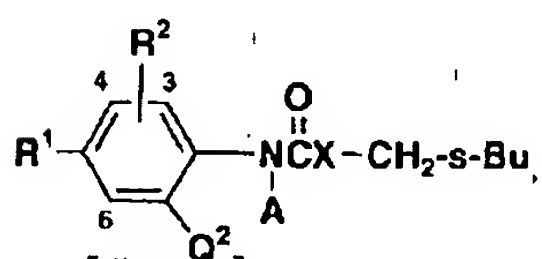
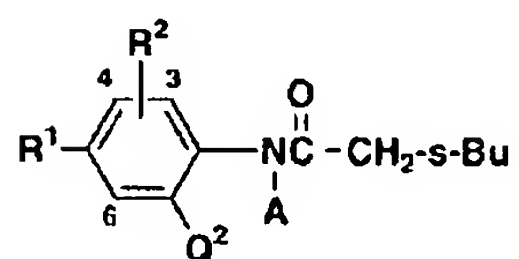
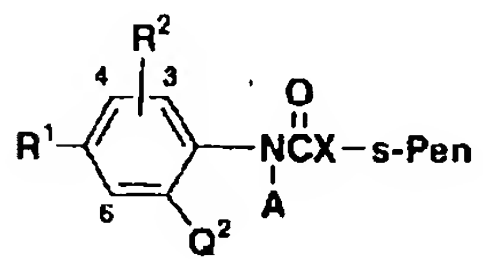
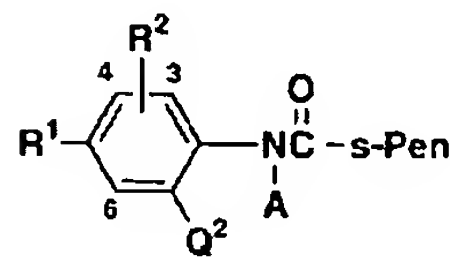
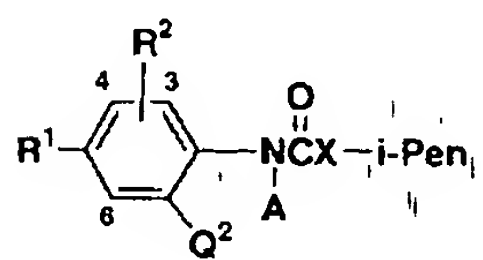
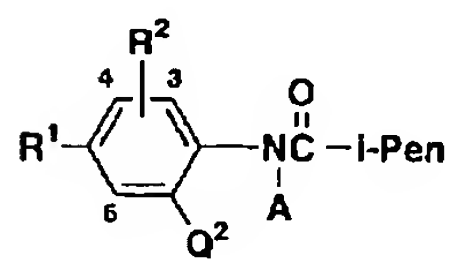
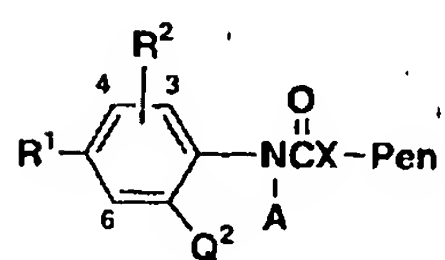
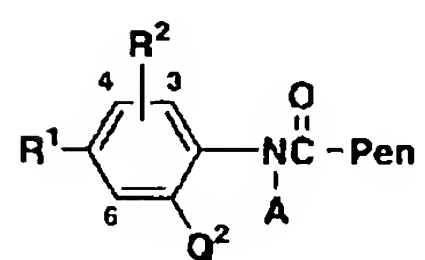
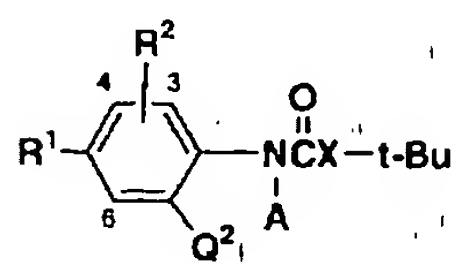
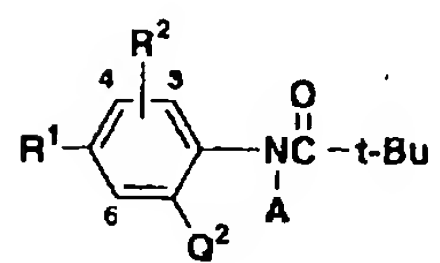
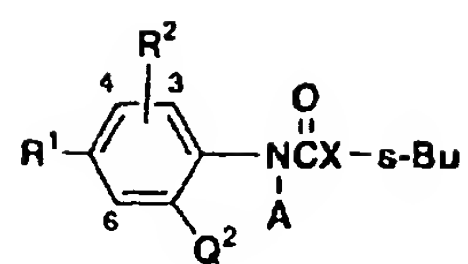
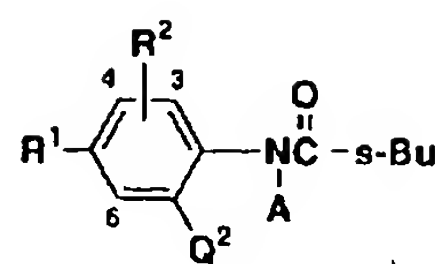
【0137】

【化59】



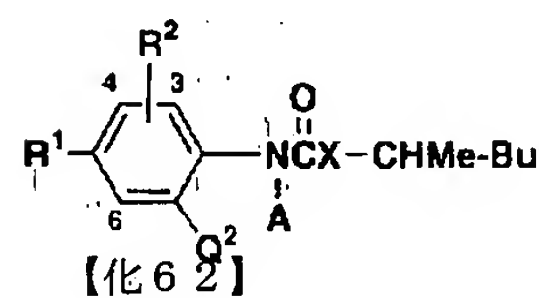
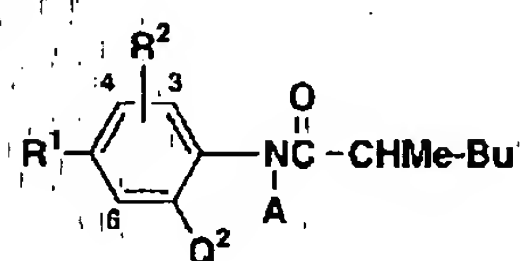
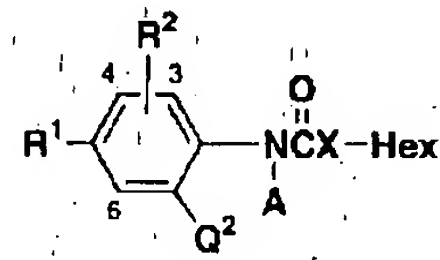
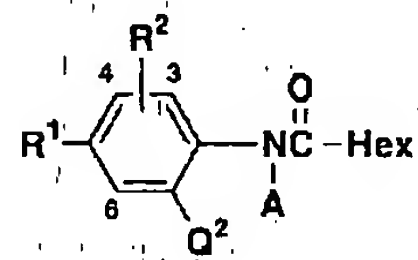
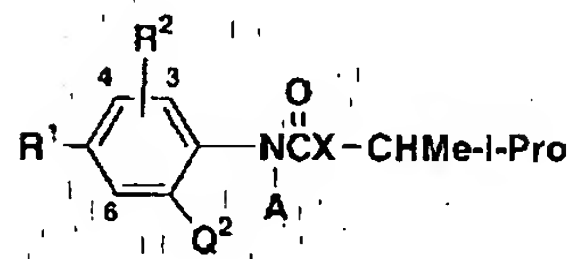
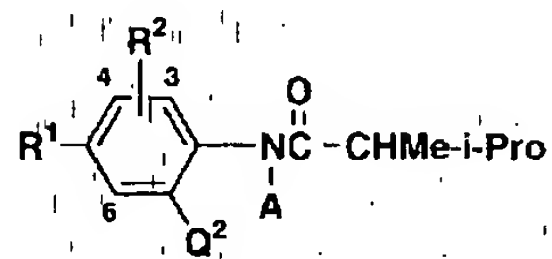
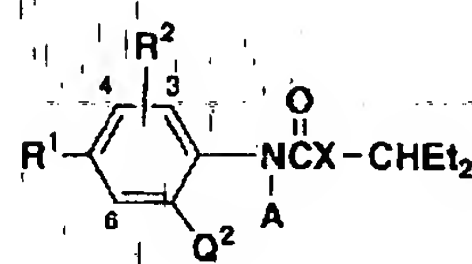
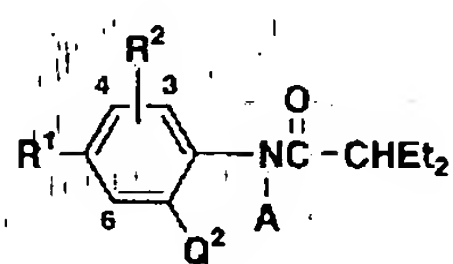
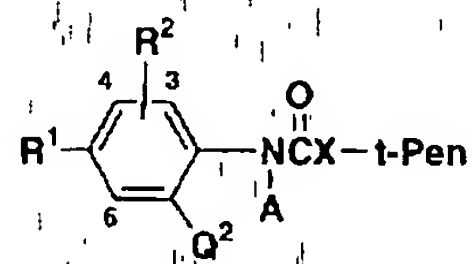
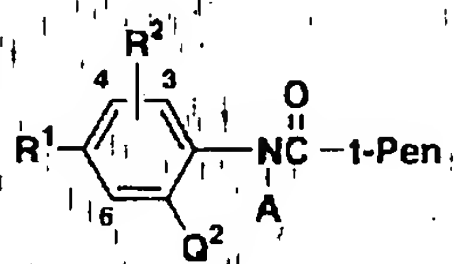
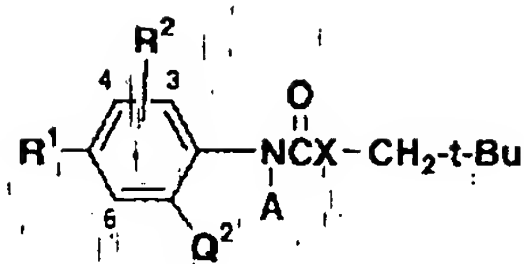
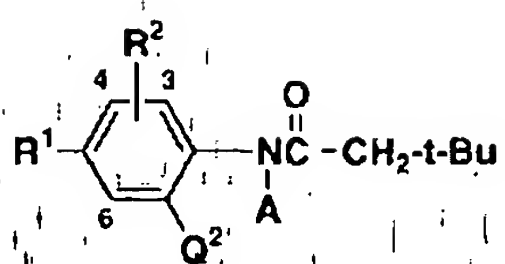
【0138】

【化60】



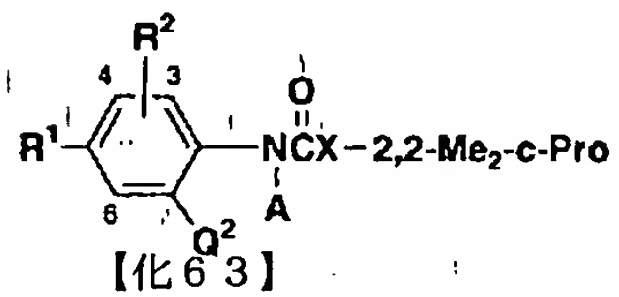
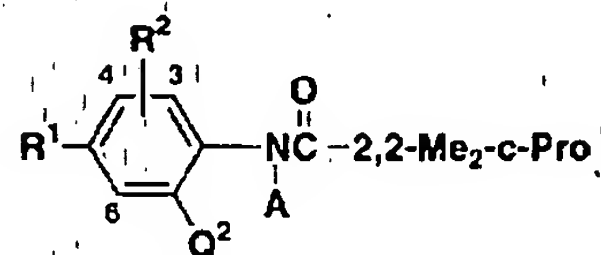
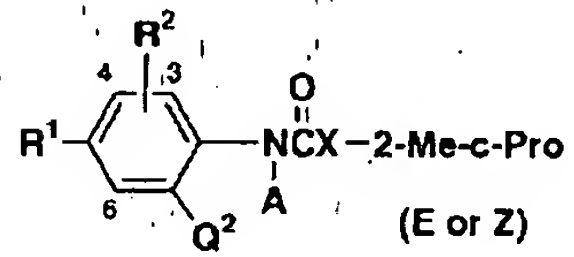
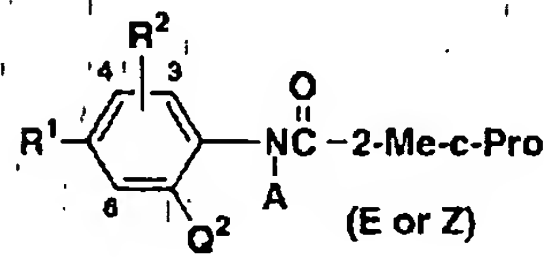
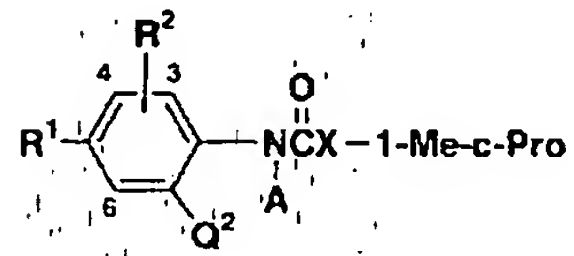
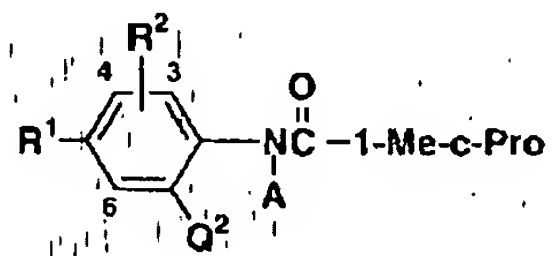
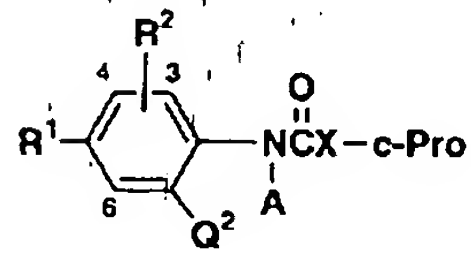
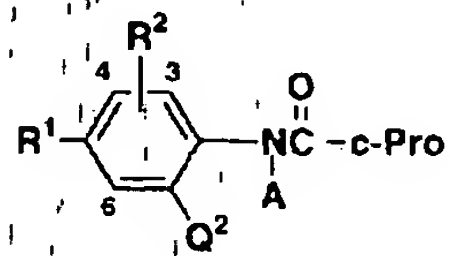
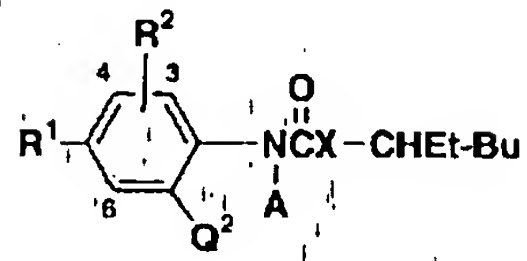
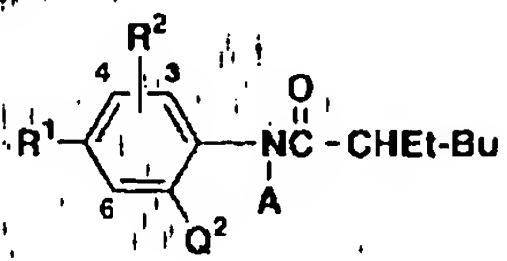
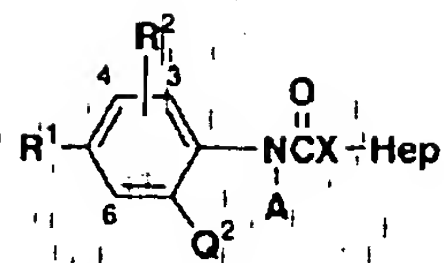
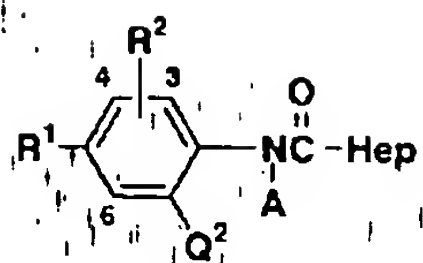
【0139】

【化61】



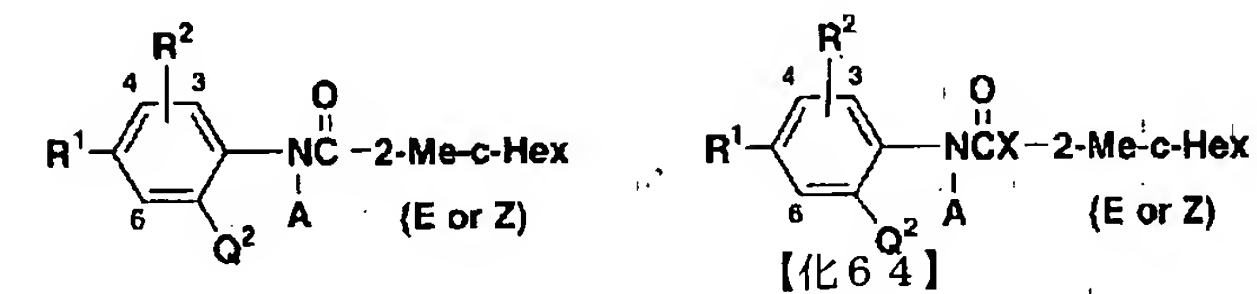
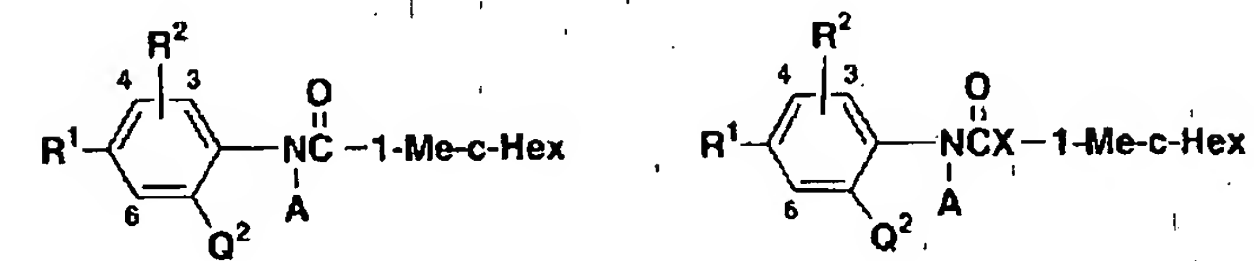
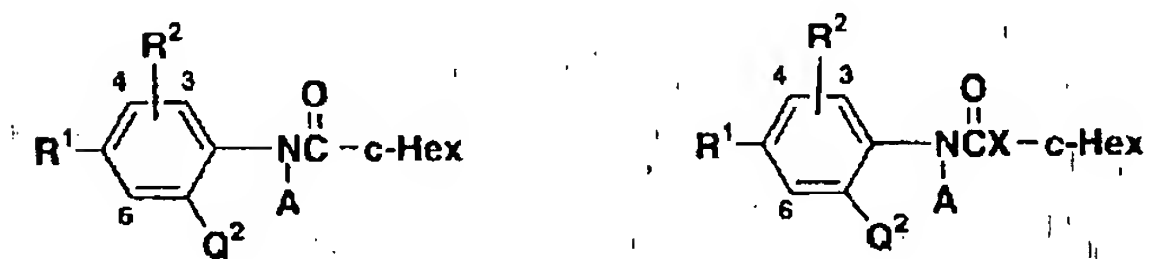
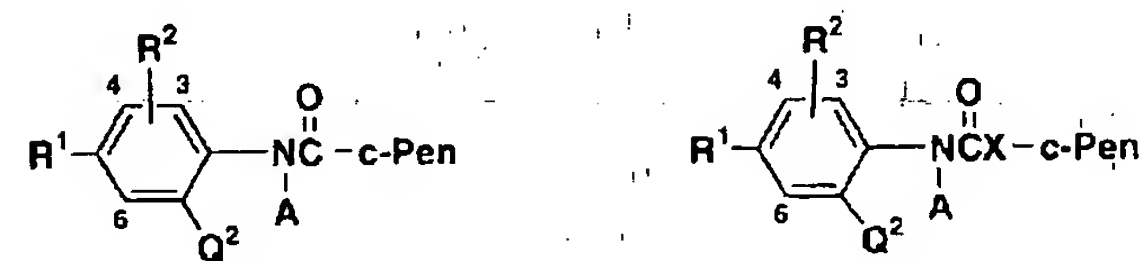
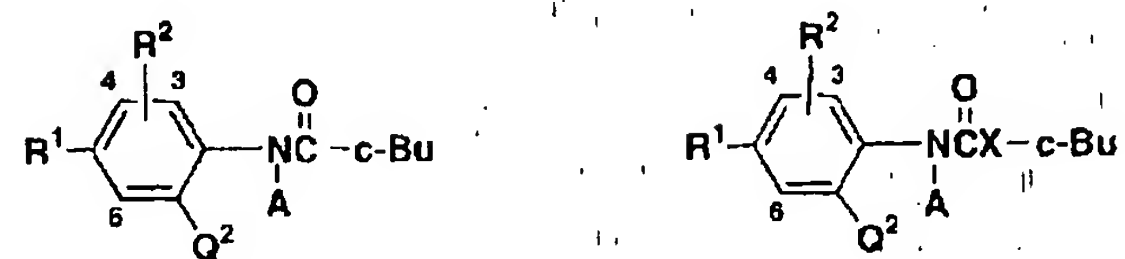
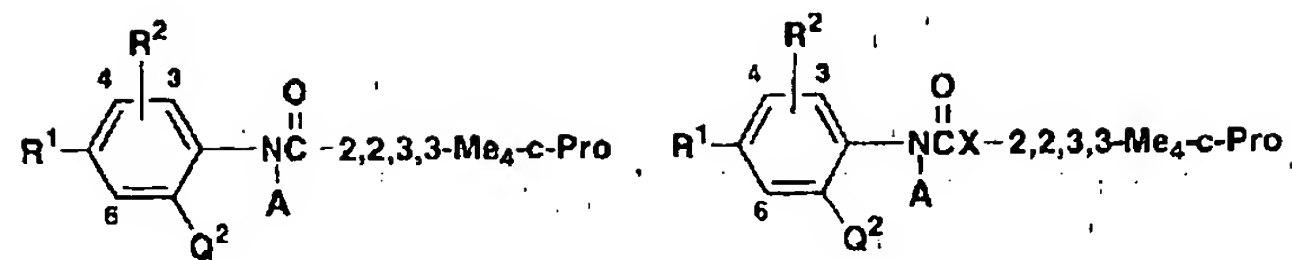
【0140】

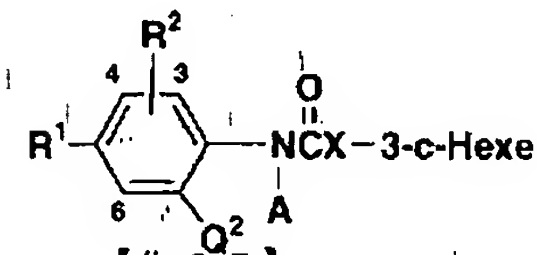
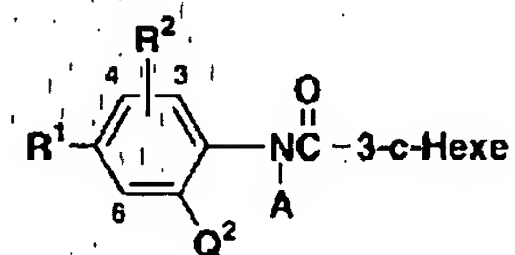
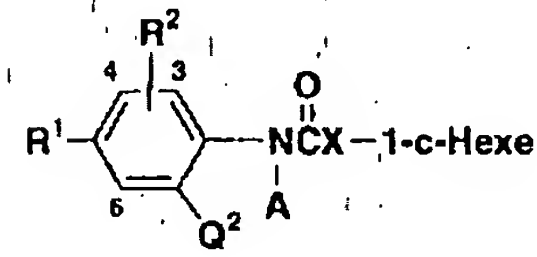
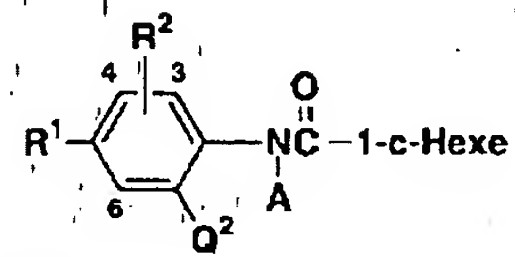
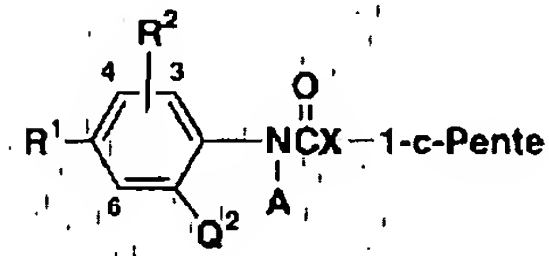
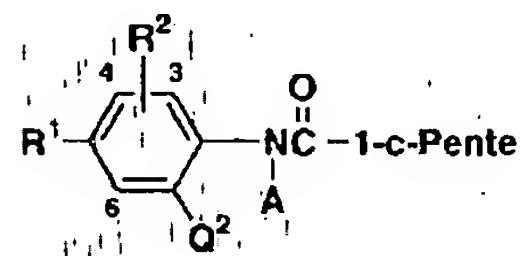
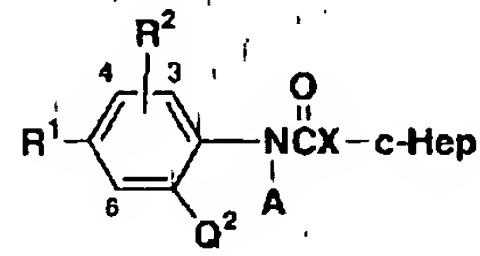
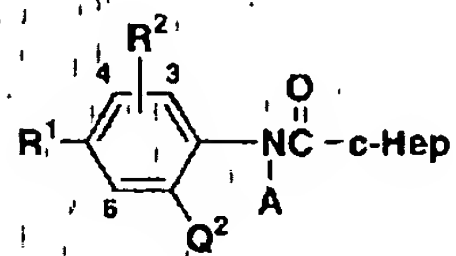
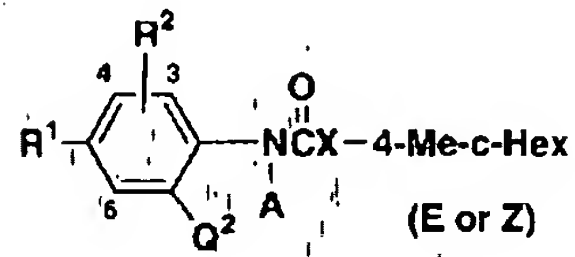
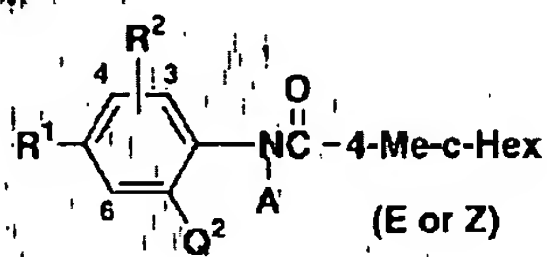
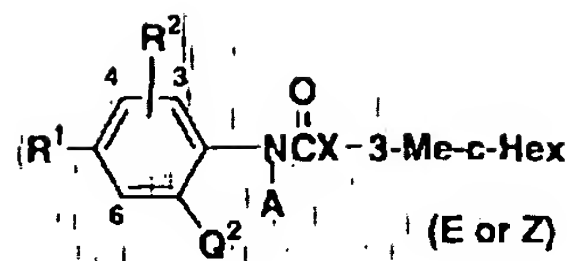
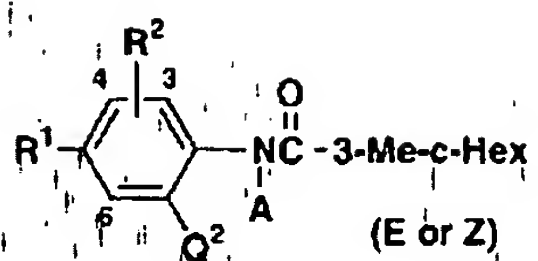
【化62】



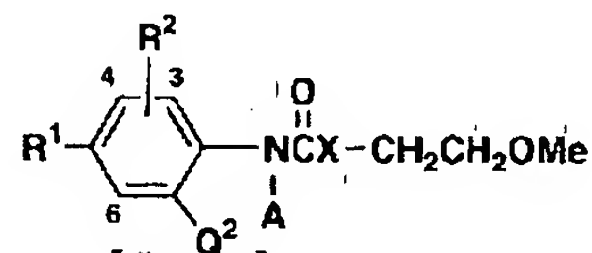
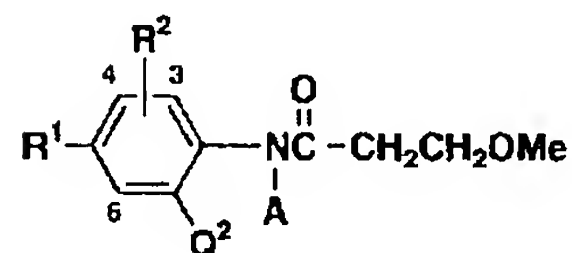
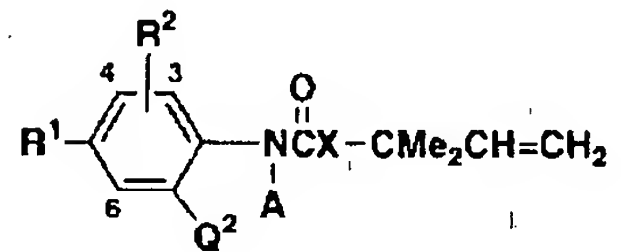
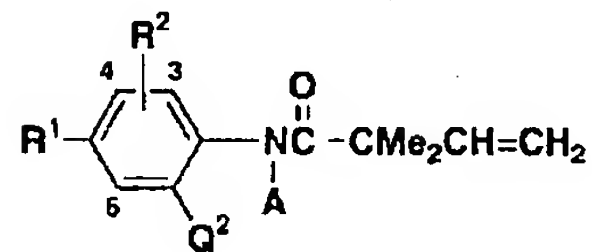
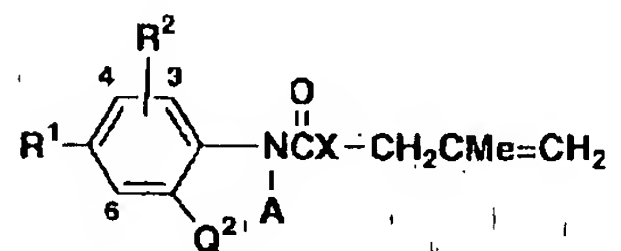
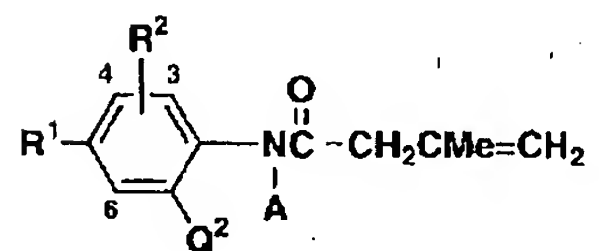
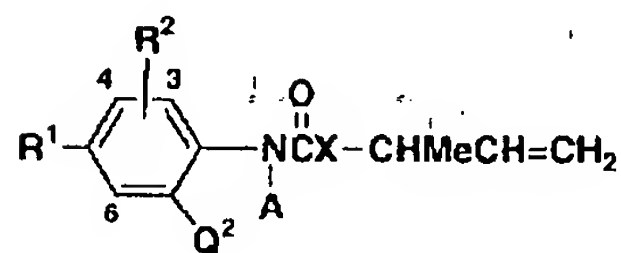
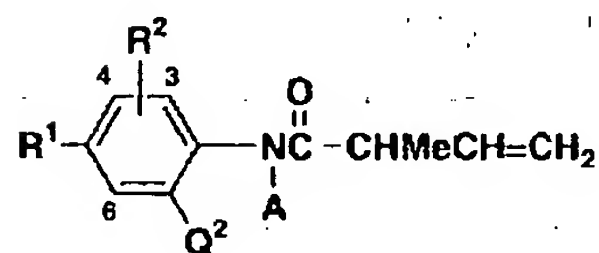
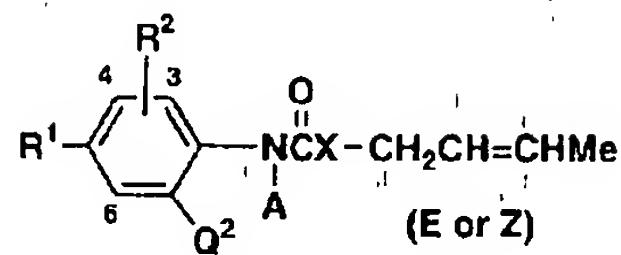
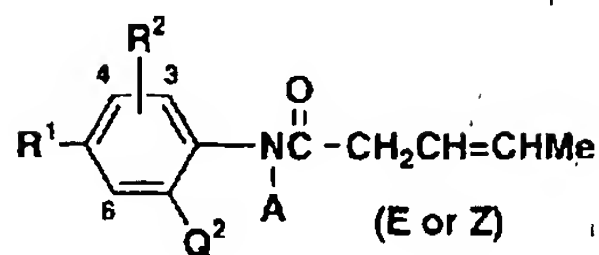
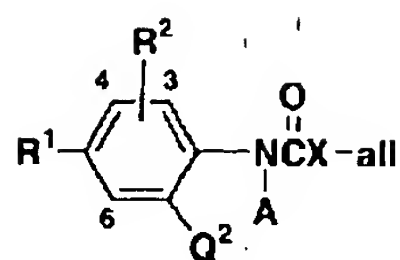
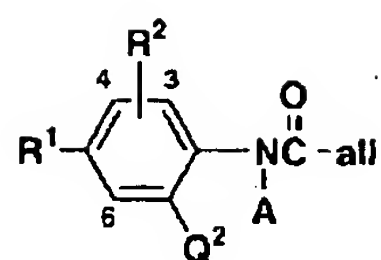
[0141]

[化63]



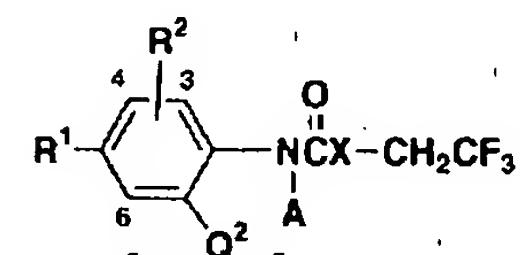
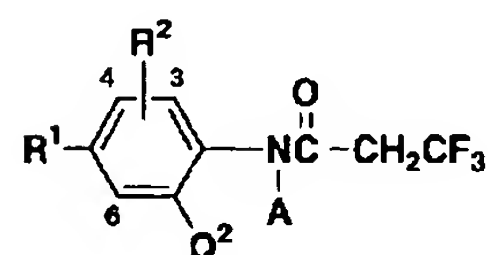
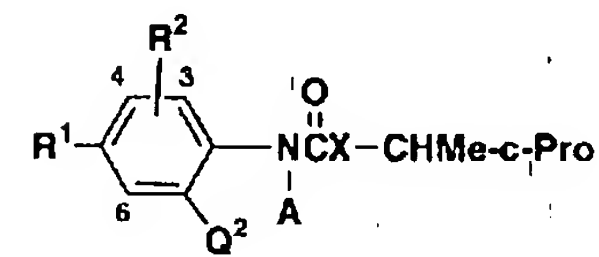
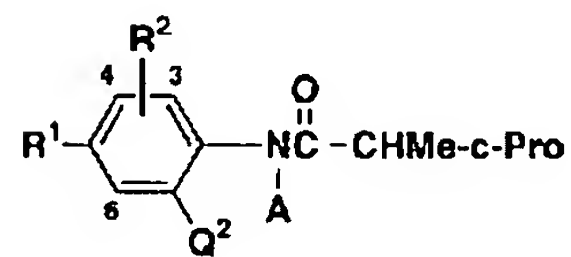
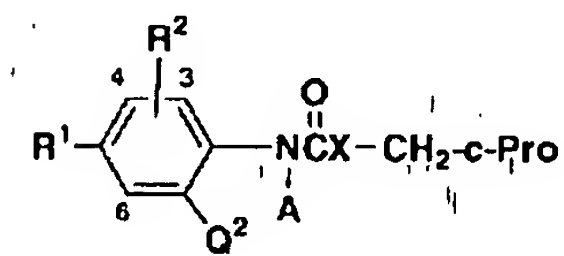
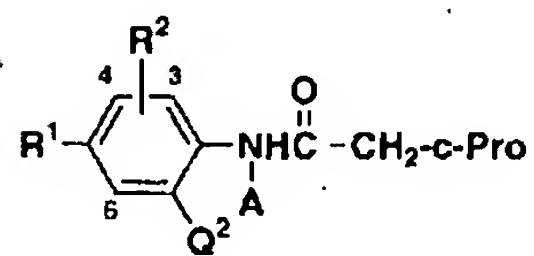
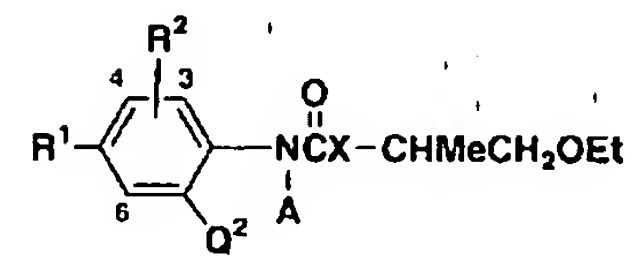
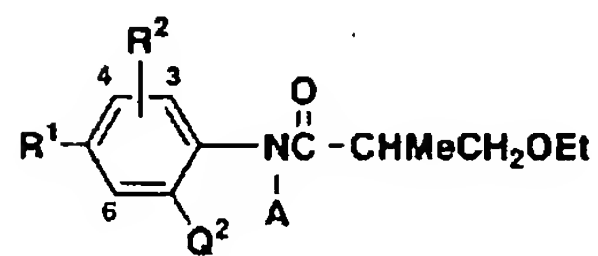
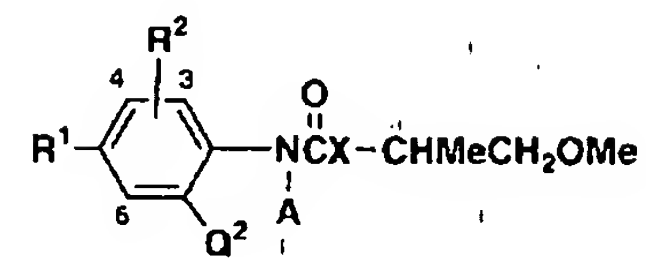
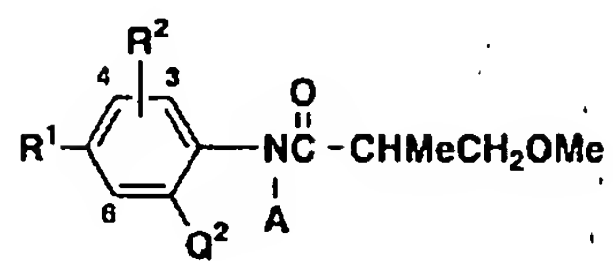
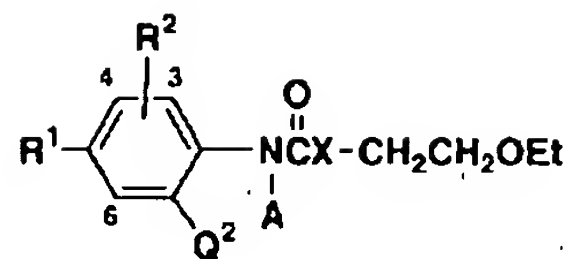
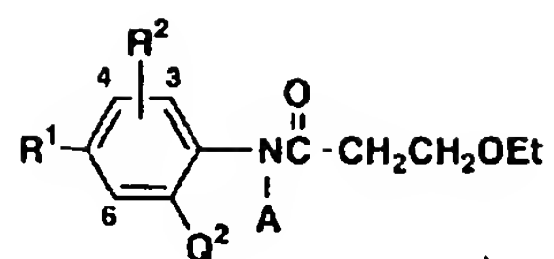


【0143】



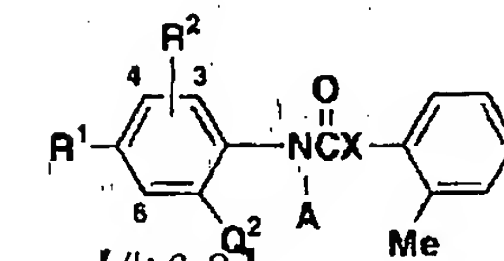
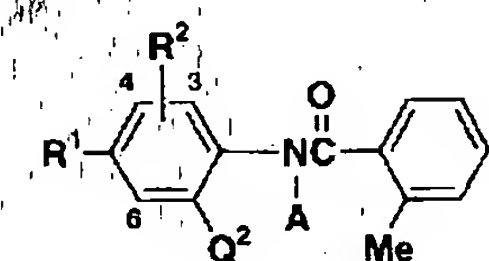
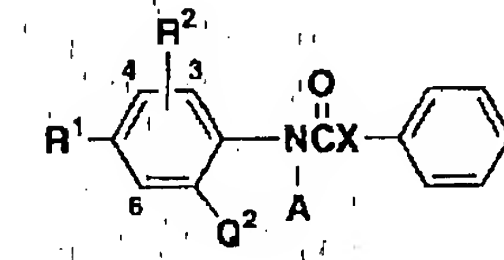
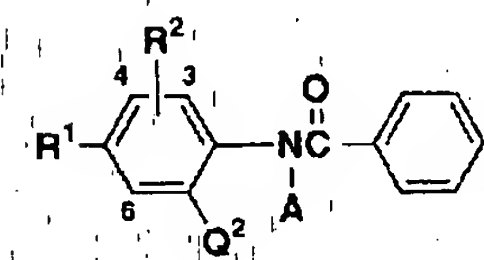
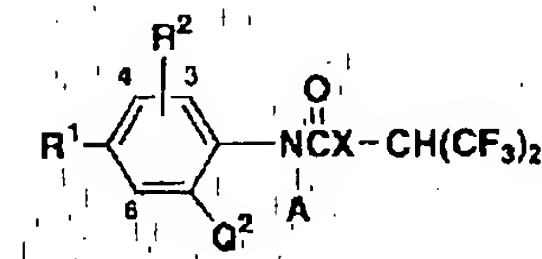
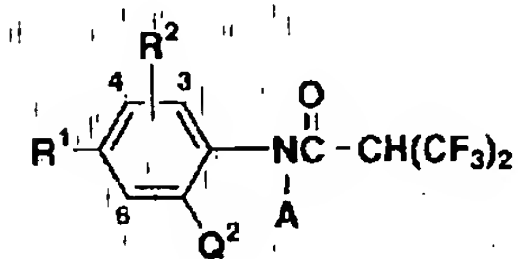
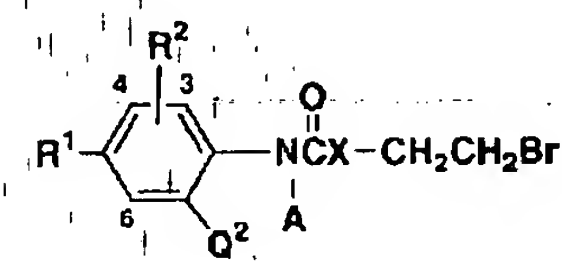
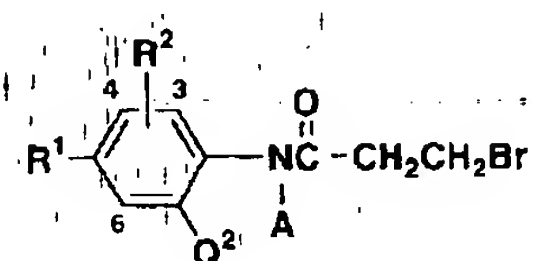
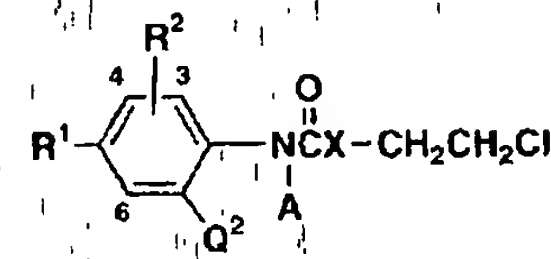
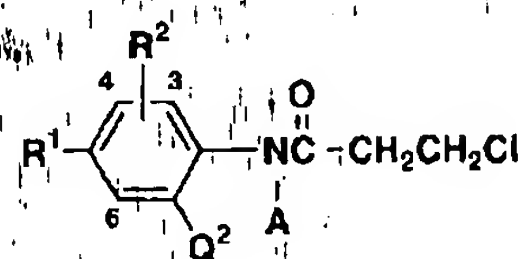
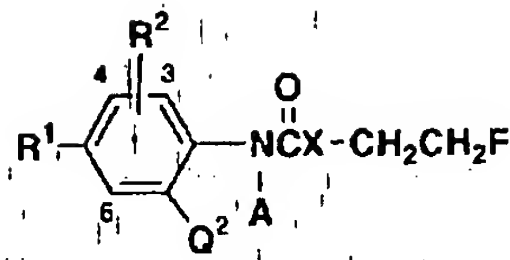
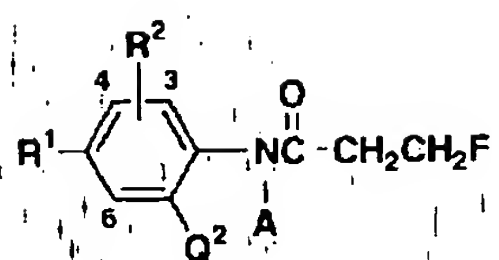
【0144】

【化66】



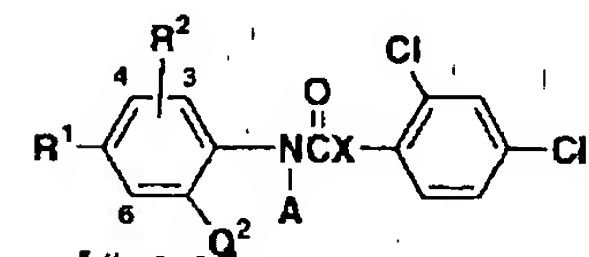
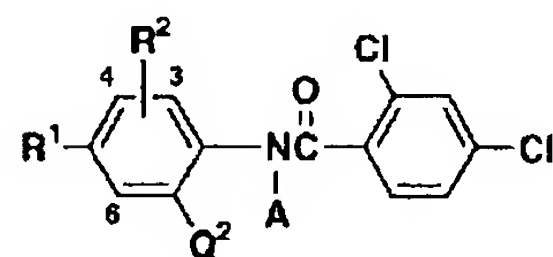
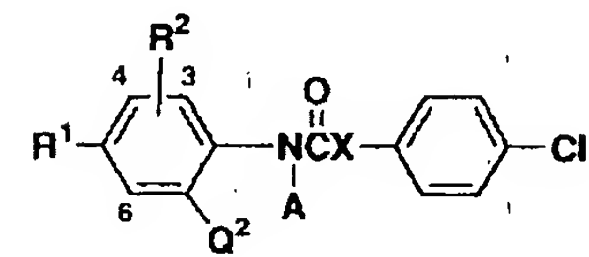
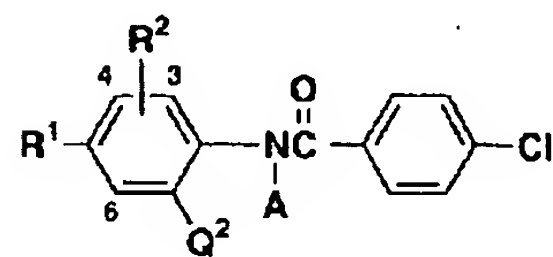
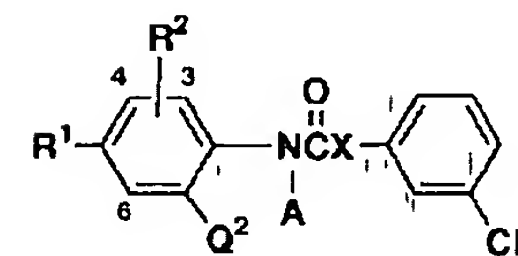
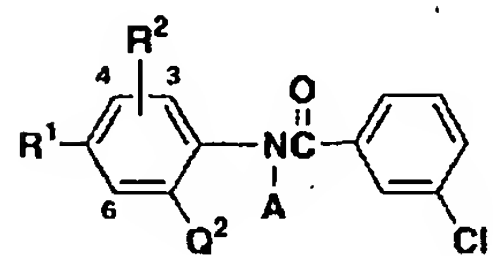
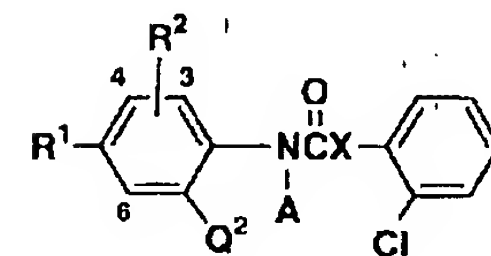
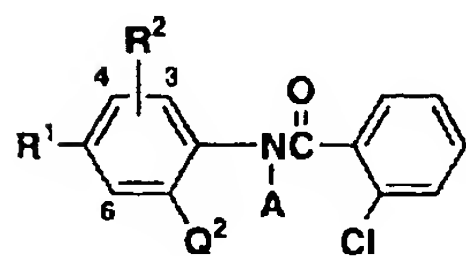
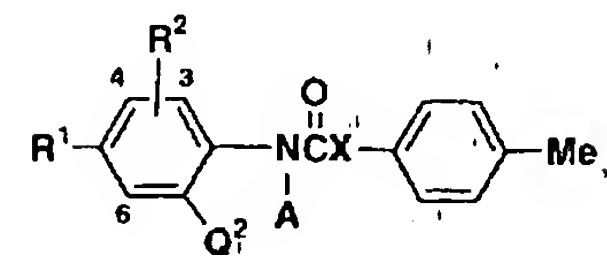
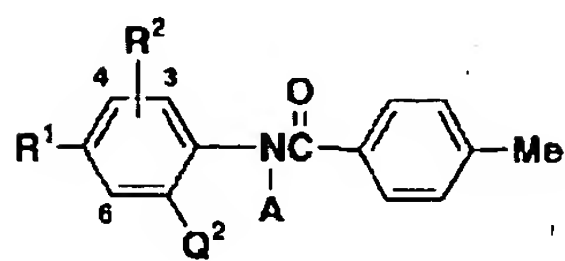
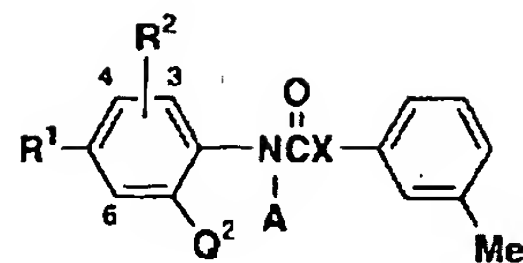
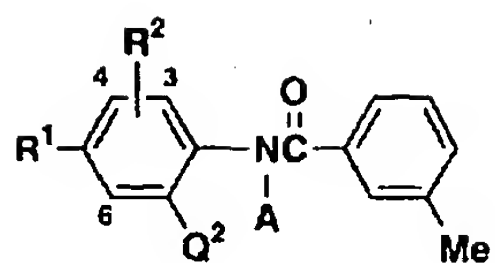
[0145]

[化67]



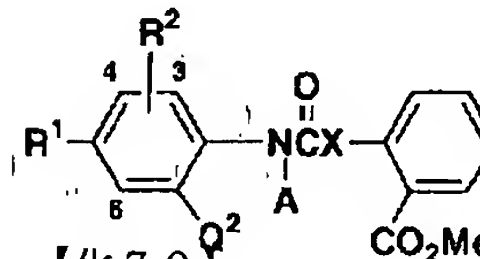
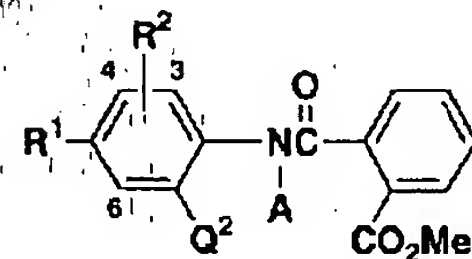
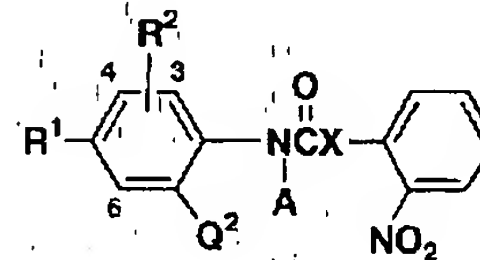
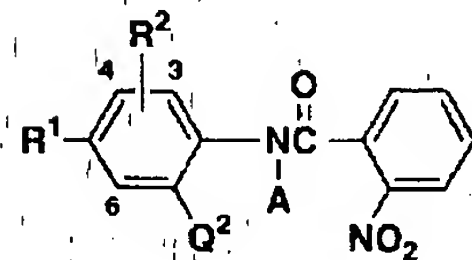
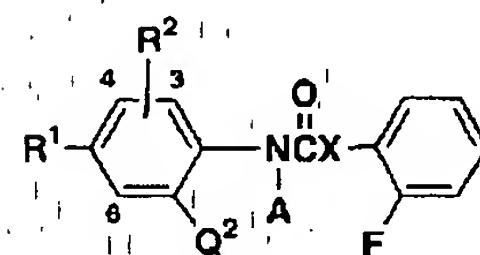
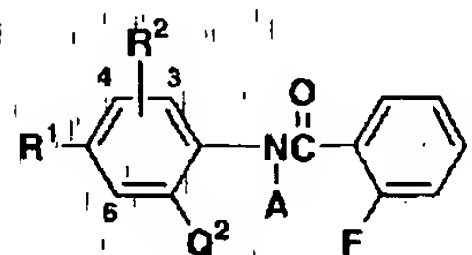
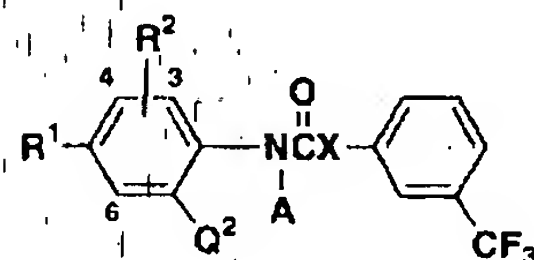
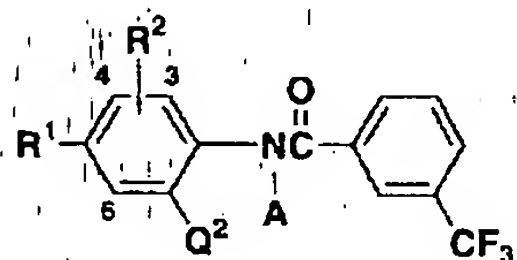
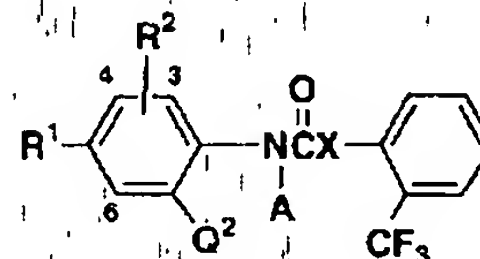
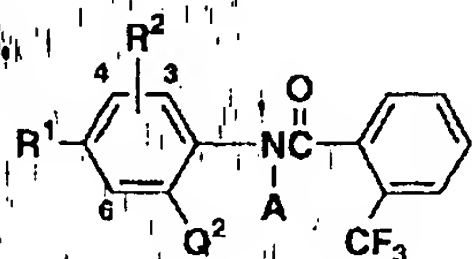
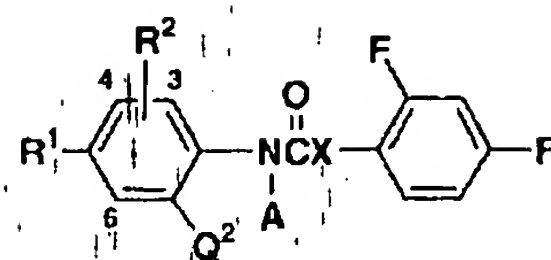
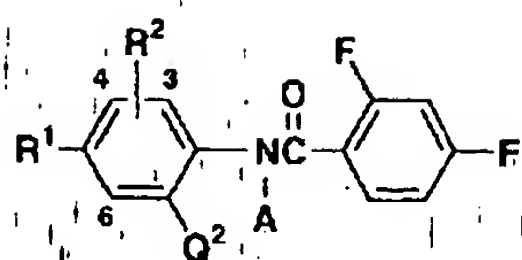
[0146]

[68]



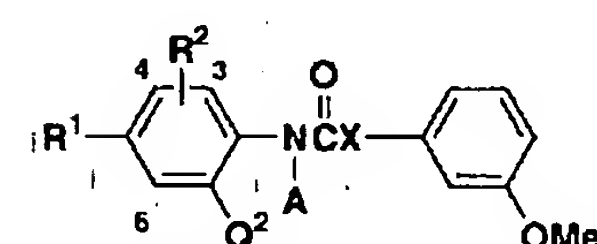
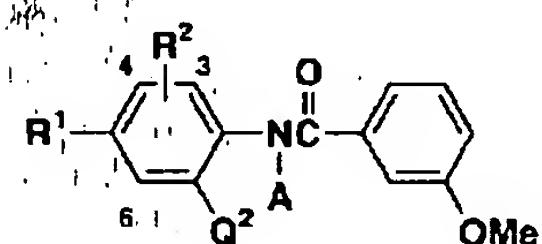
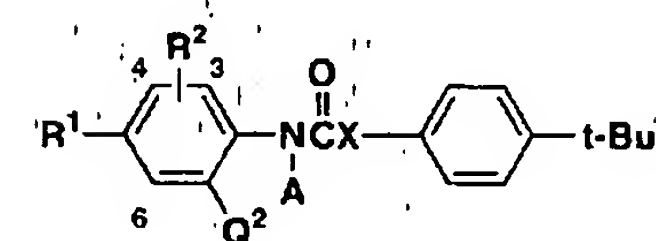
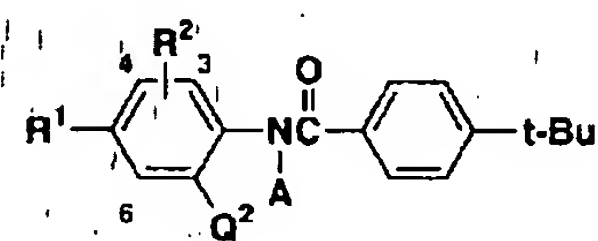
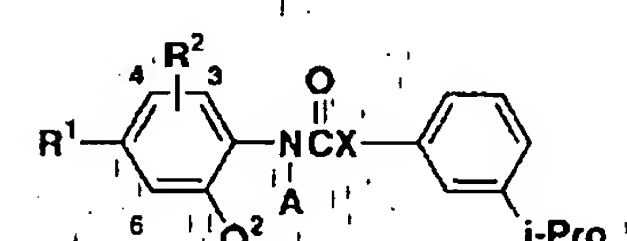
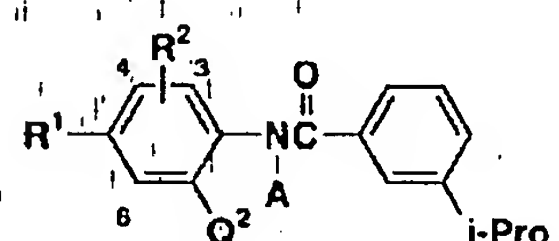
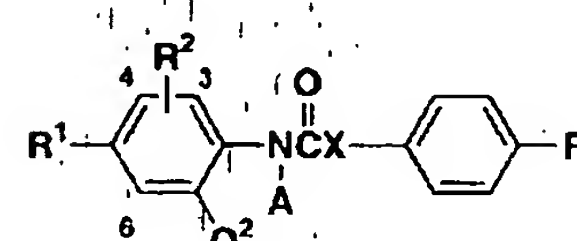
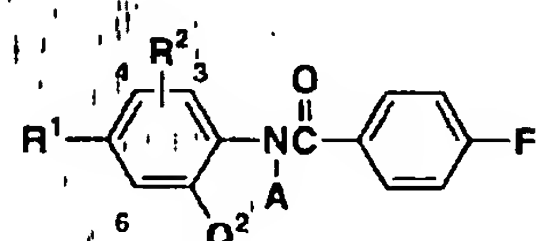
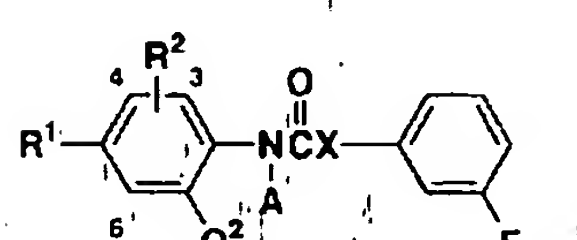
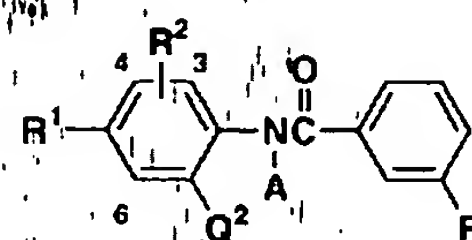
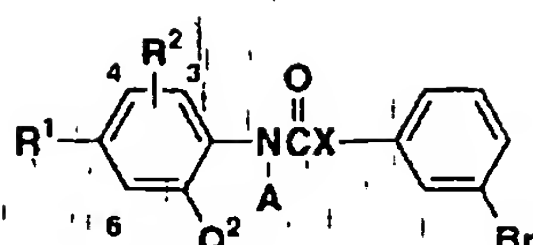
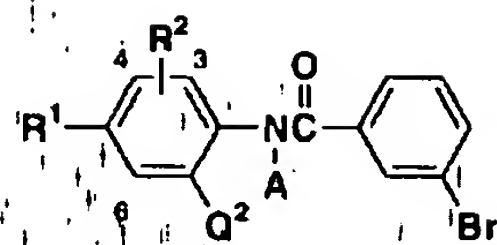
【0147】

【化69】



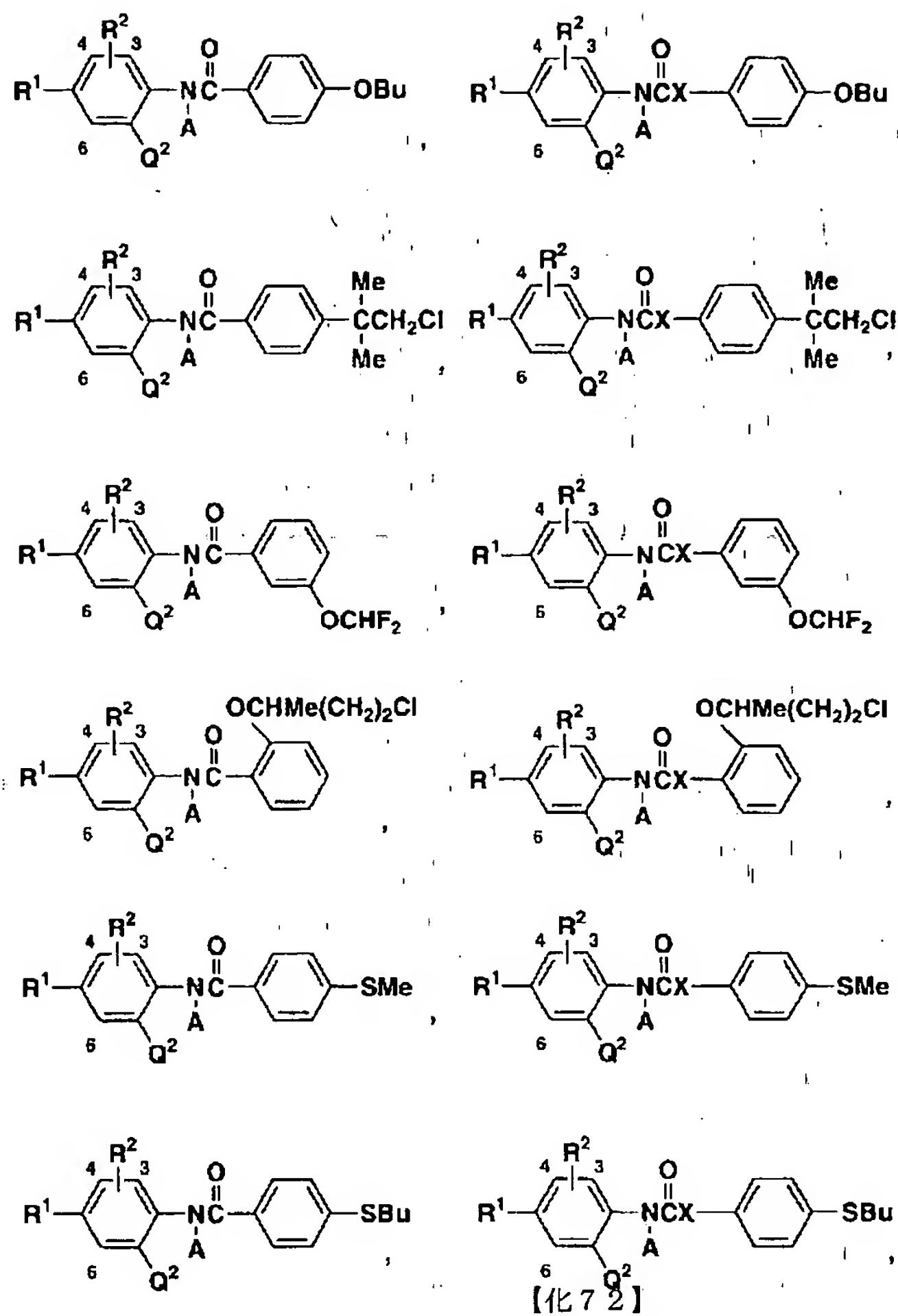
【0148】

【化70】



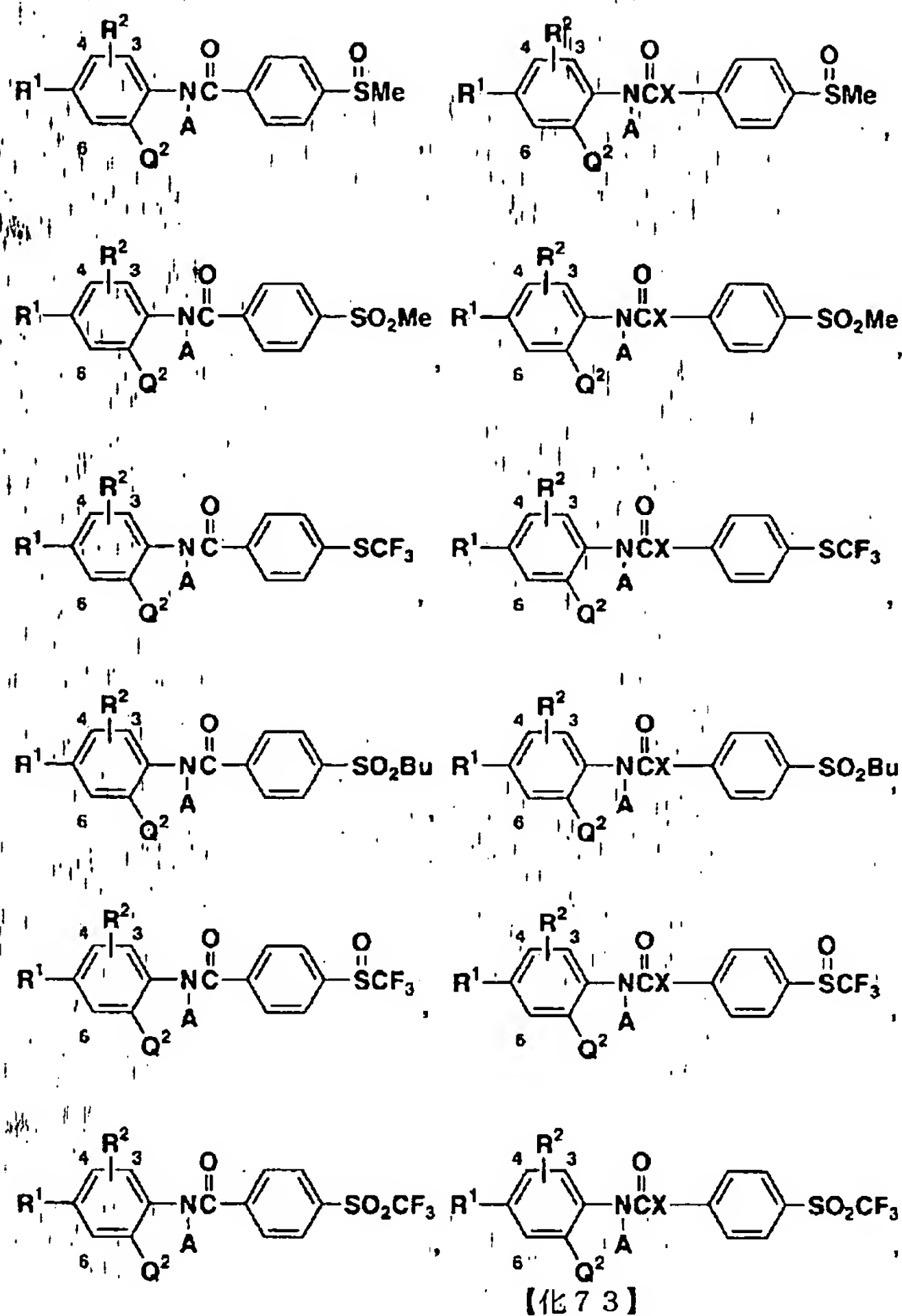
【0149】

【化71】



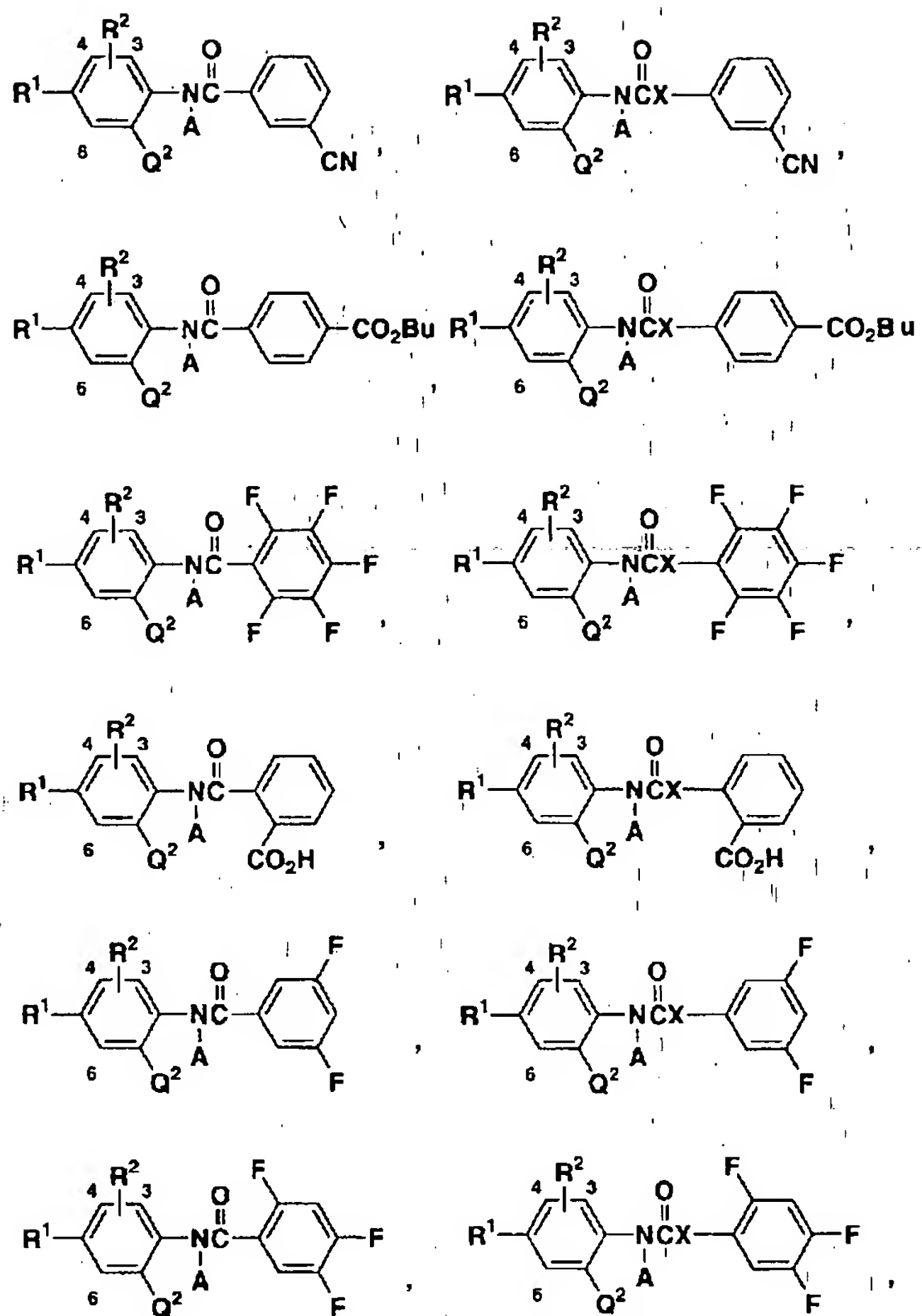
【0150】

【化72】



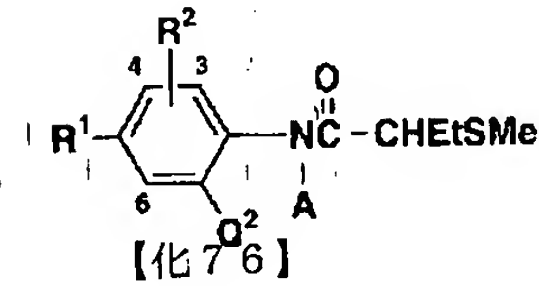
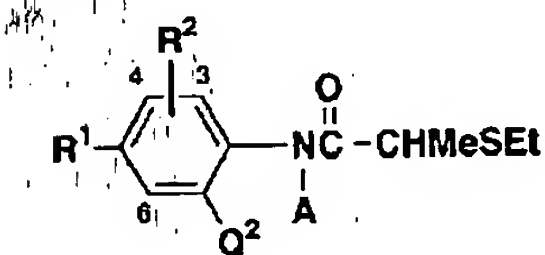
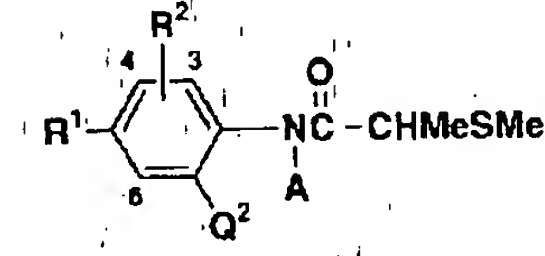
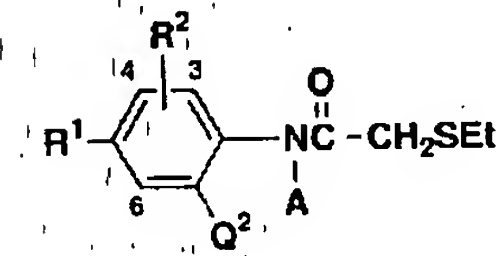
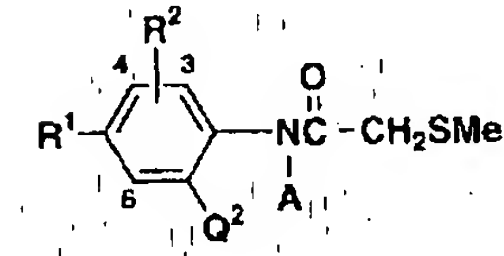
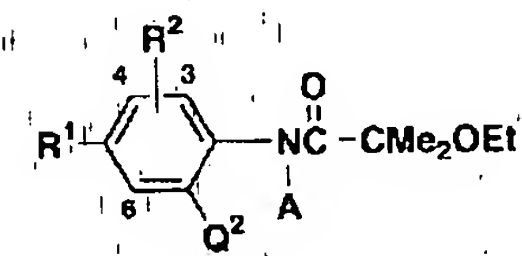
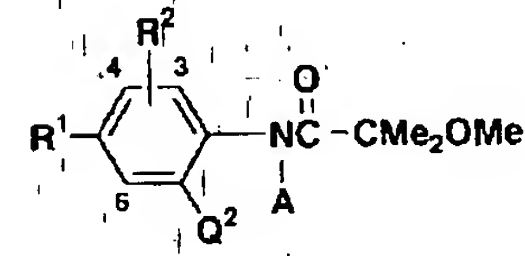
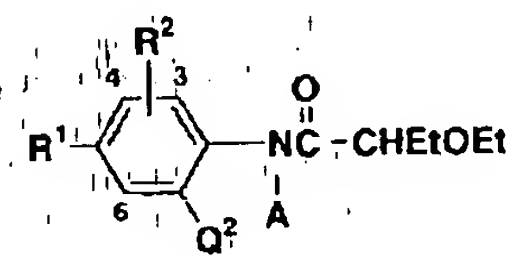
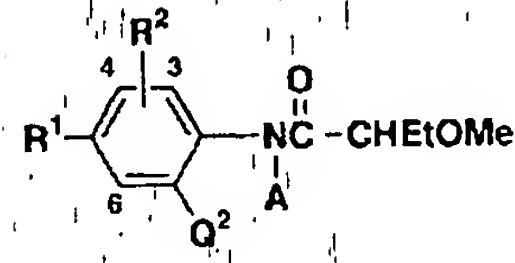
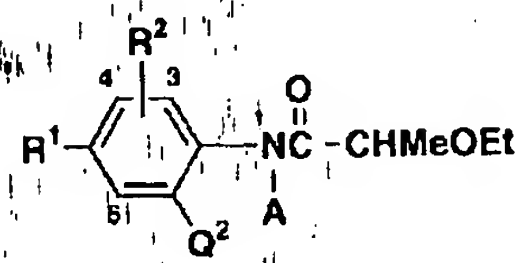
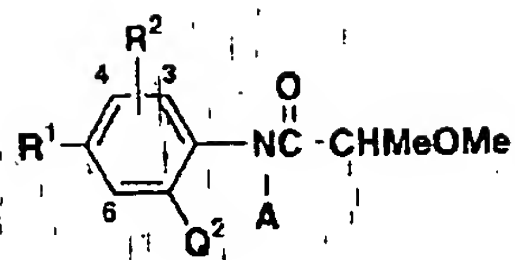
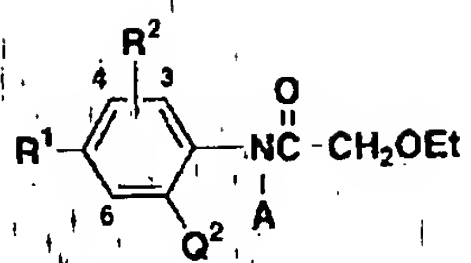
【0151】

【化73】



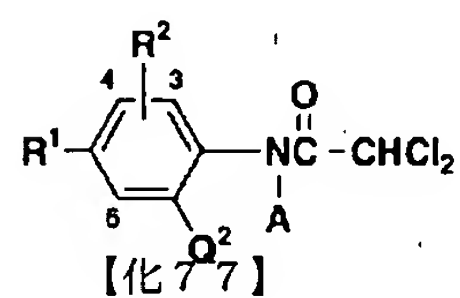
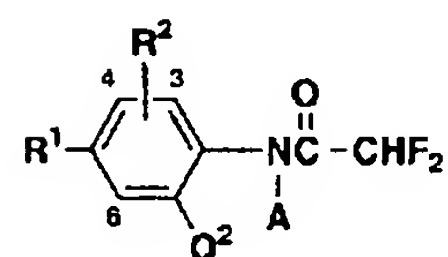
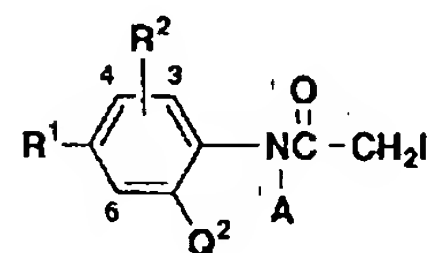
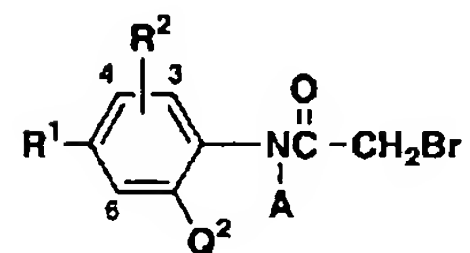
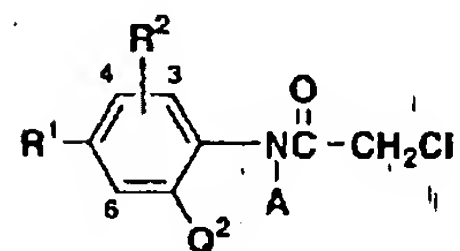
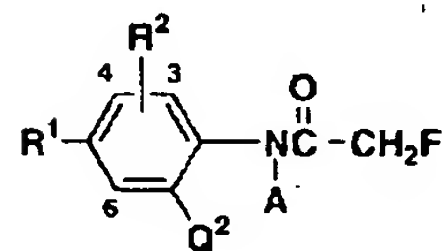
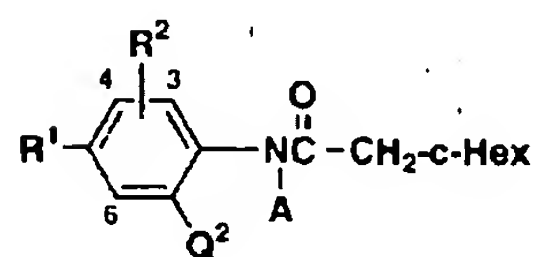
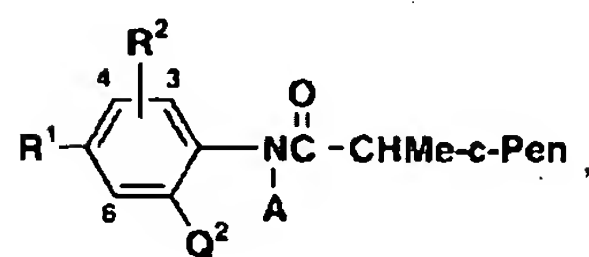
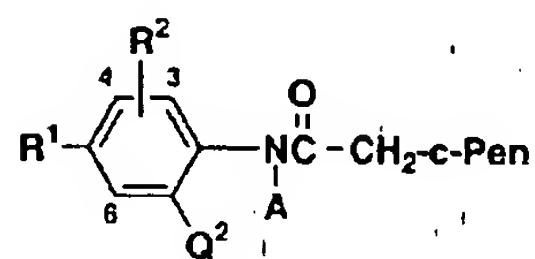
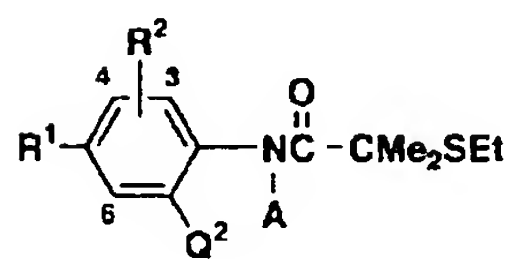
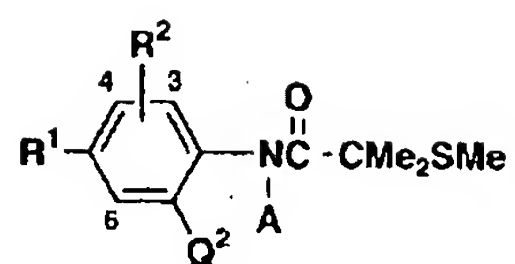
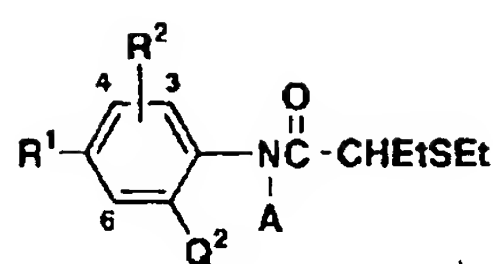
【0152】

【化74】



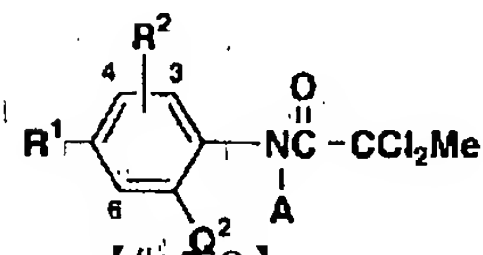
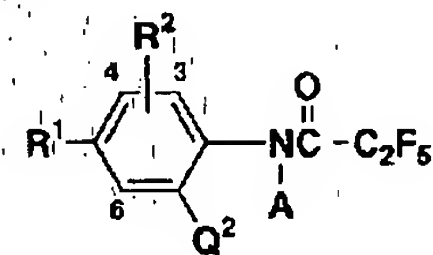
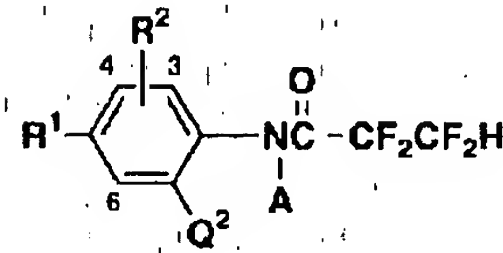
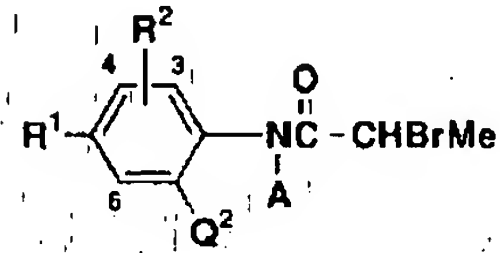
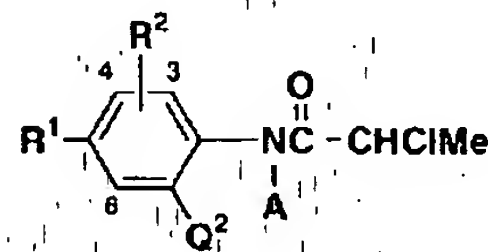
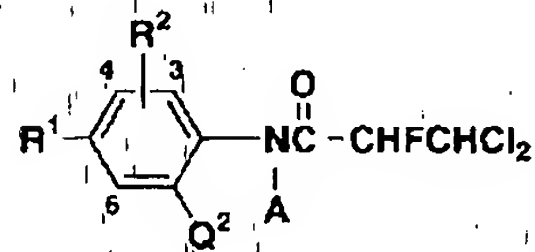
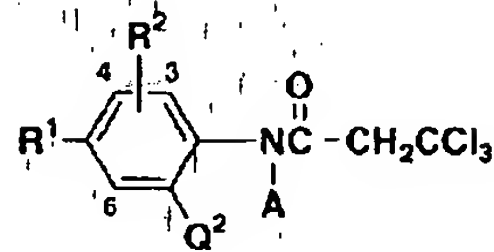
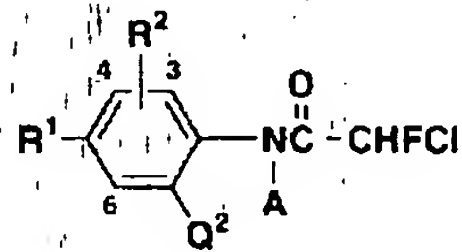
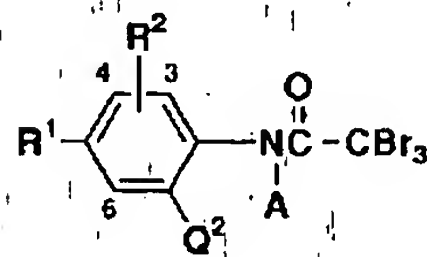
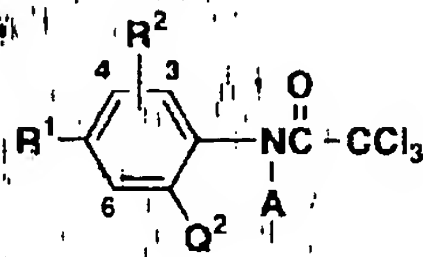
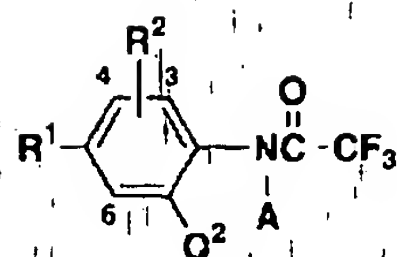
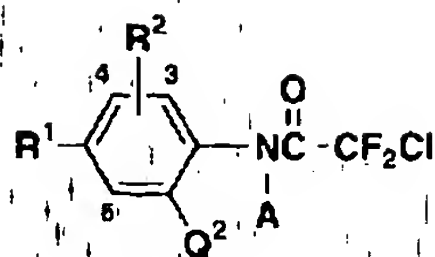
[0154]

[化76]



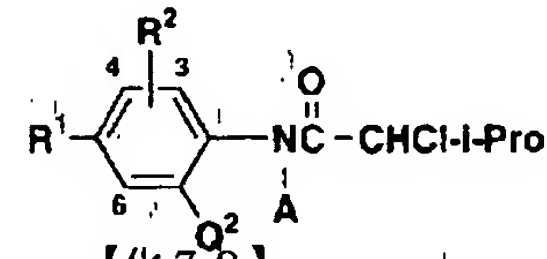
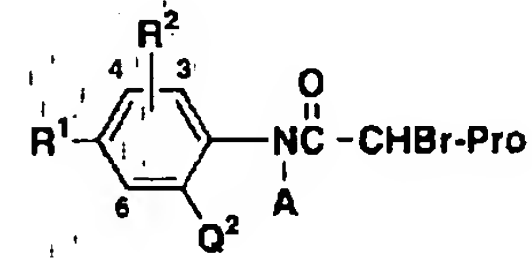
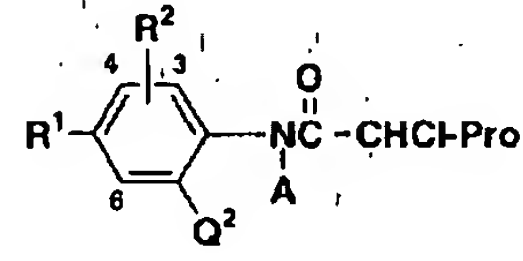
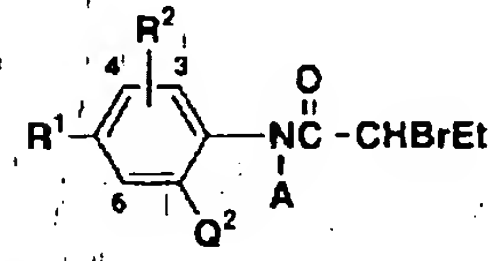
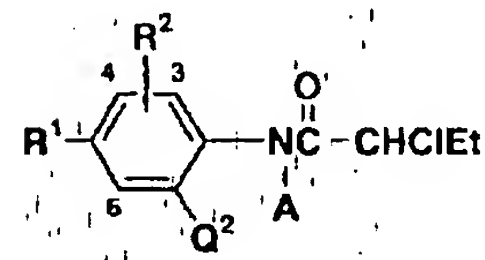
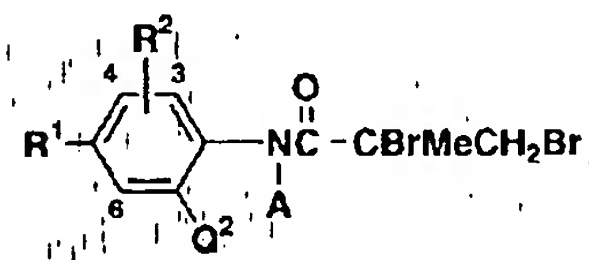
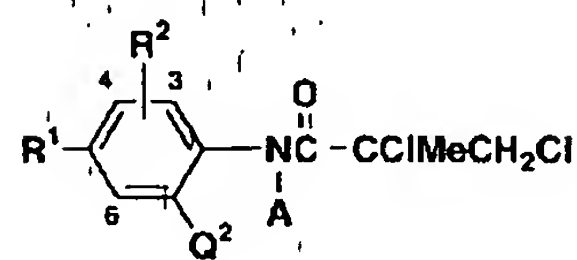
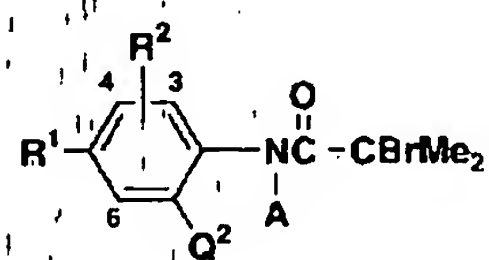
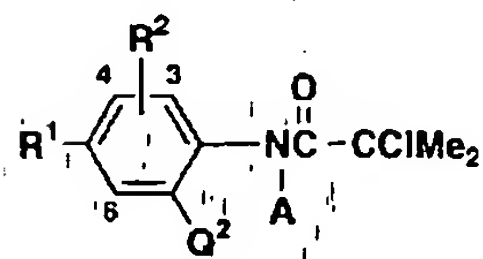
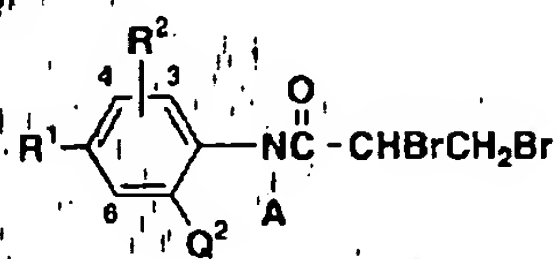
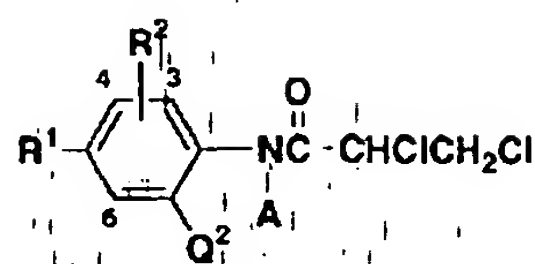
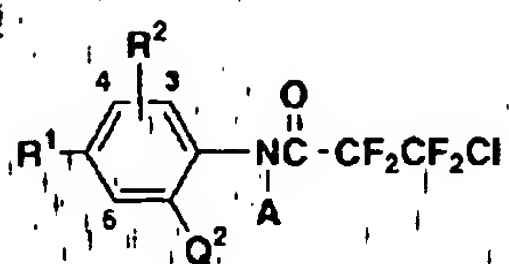
[0155]

[化77]



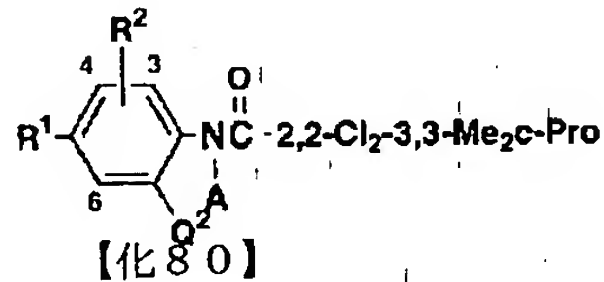
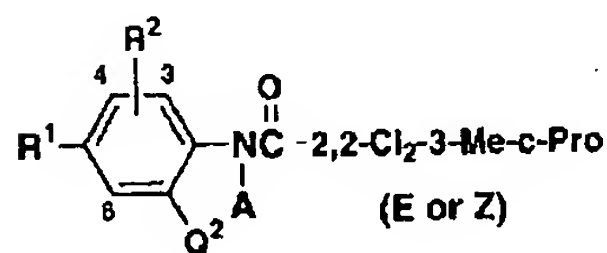
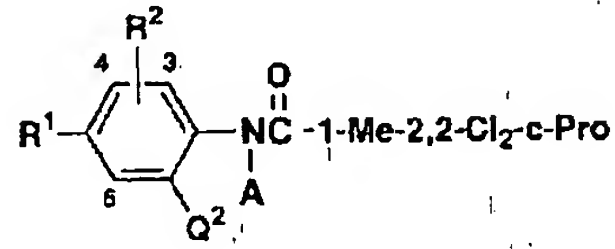
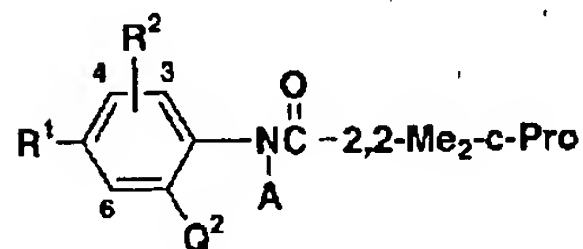
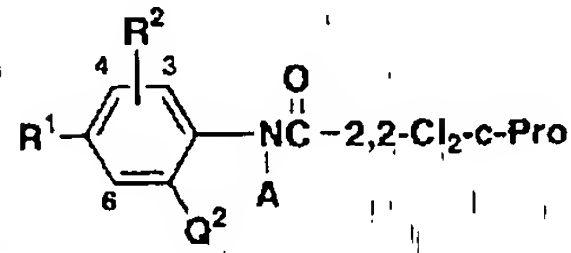
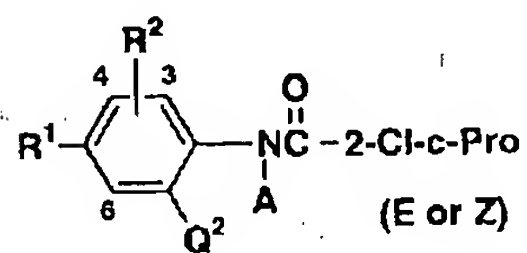
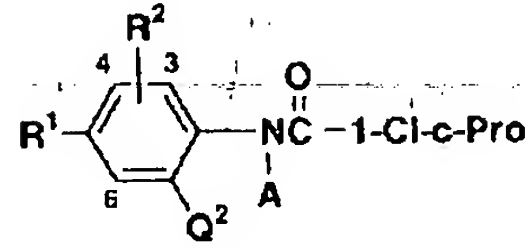
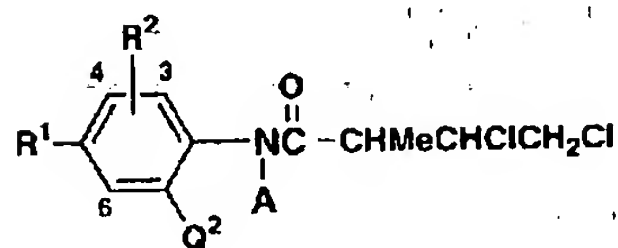
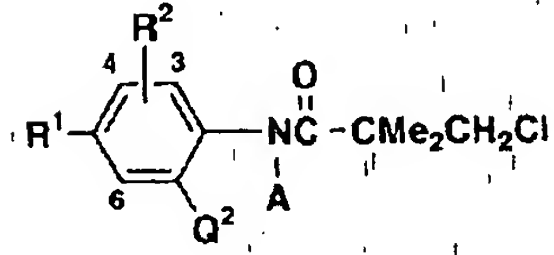
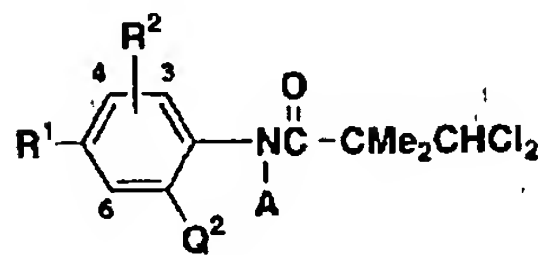
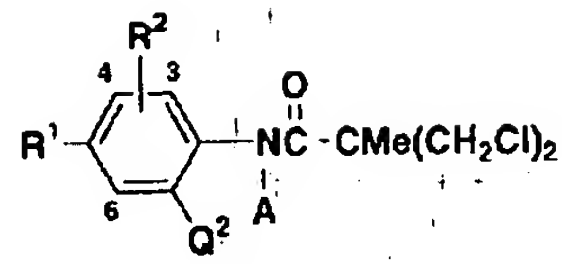
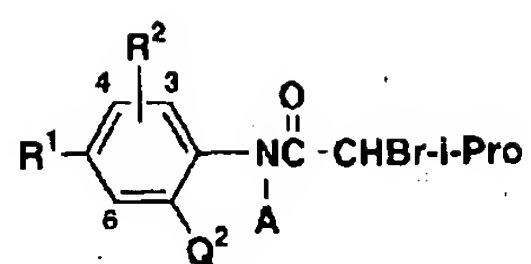
[0156]

[化78]



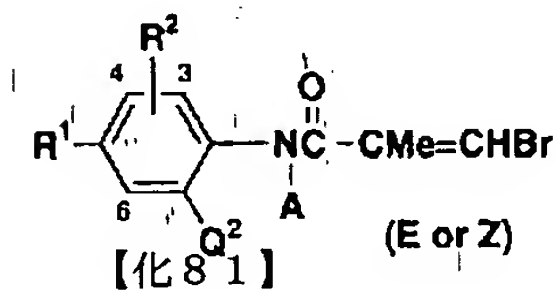
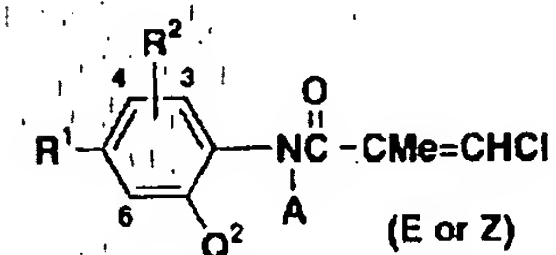
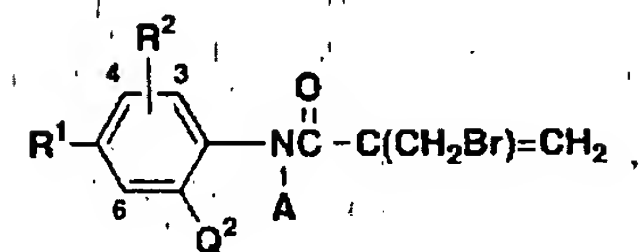
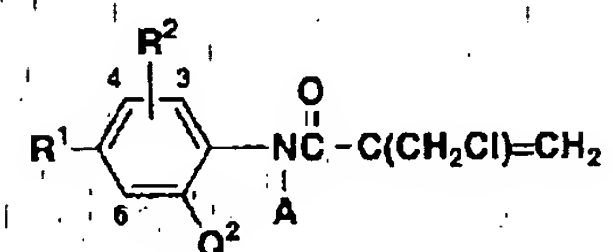
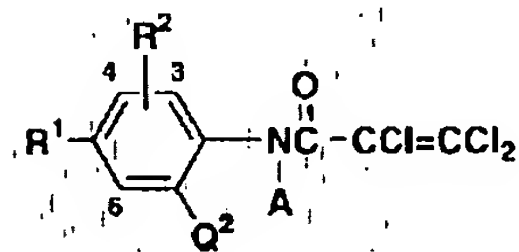
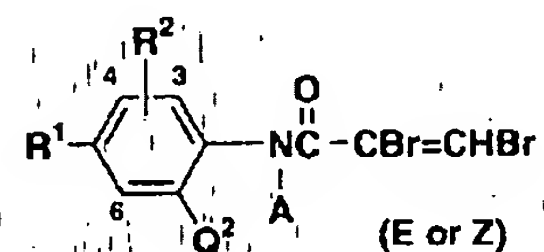
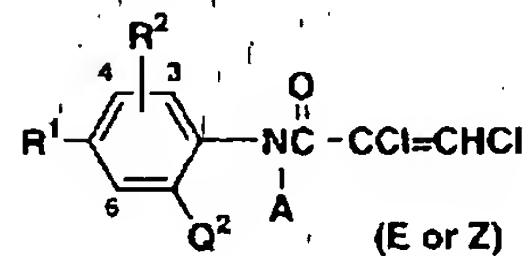
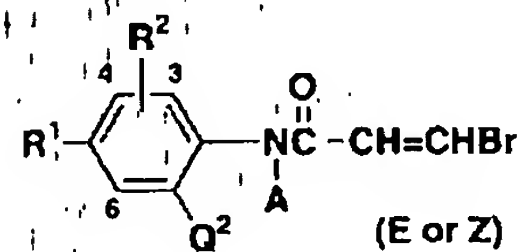
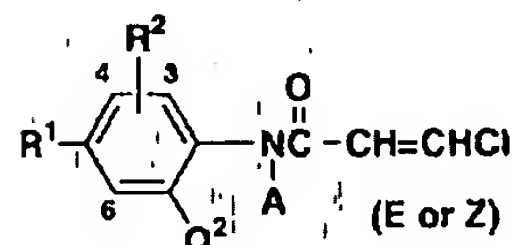
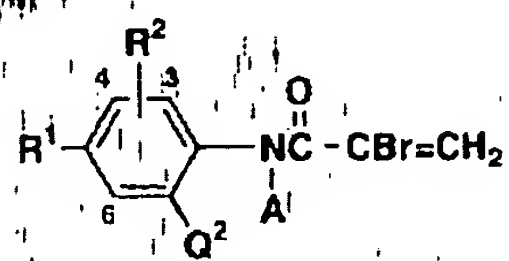
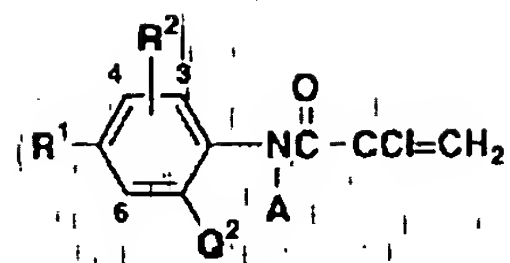
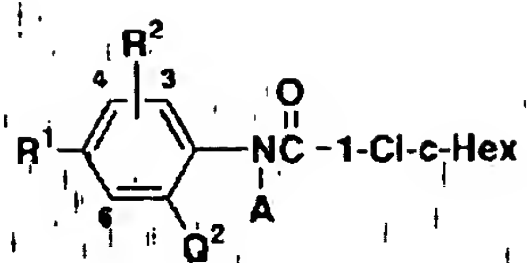
[0157]

[化79]



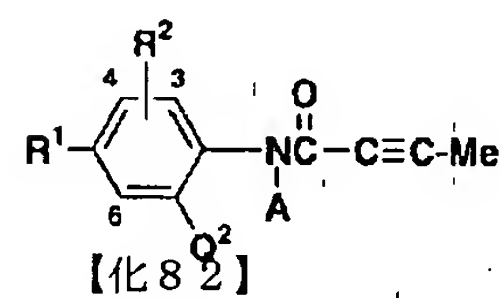
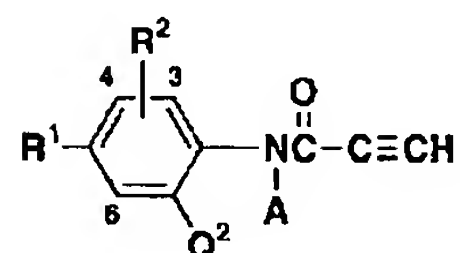
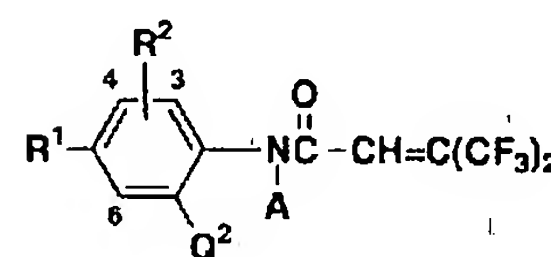
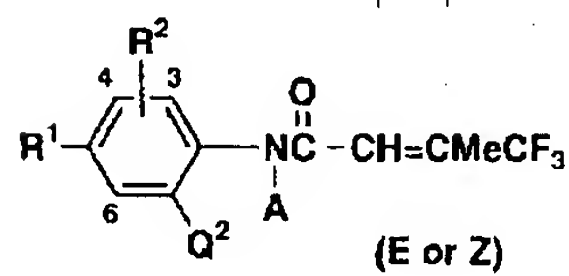
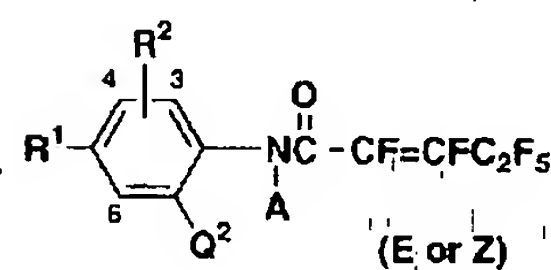
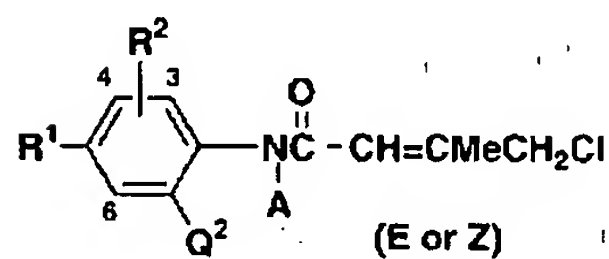
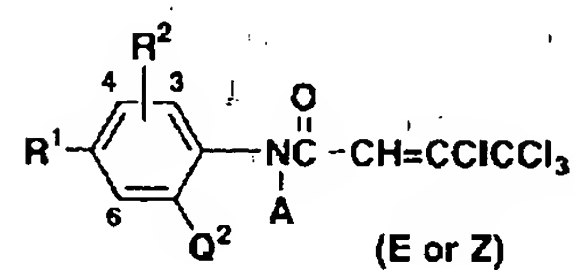
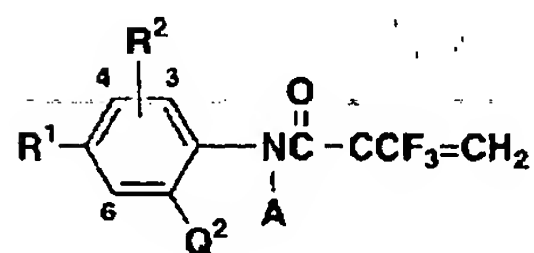
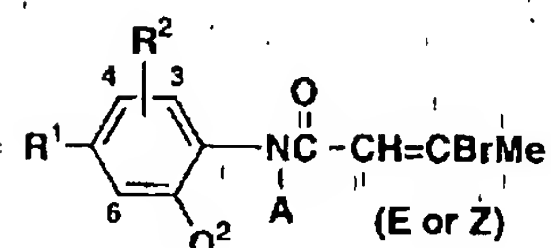
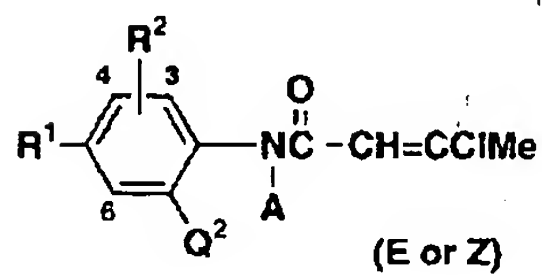
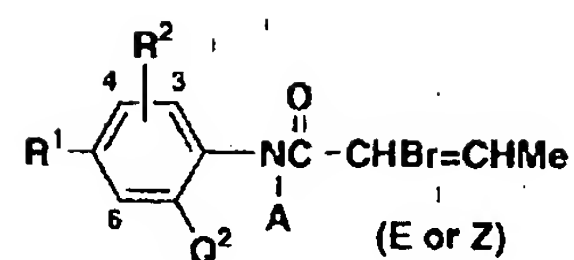
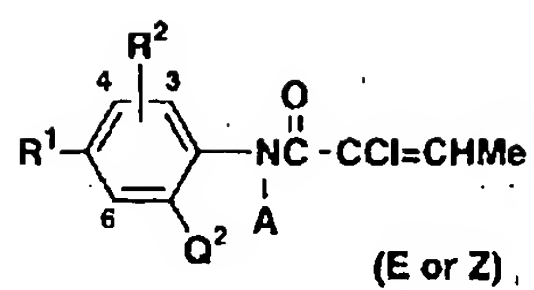
【0158】

【化80】

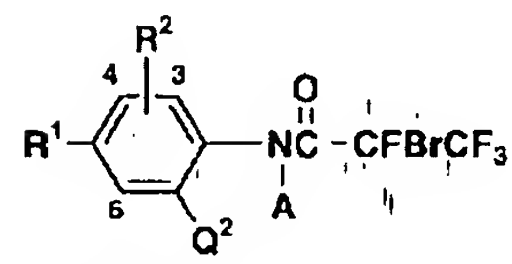
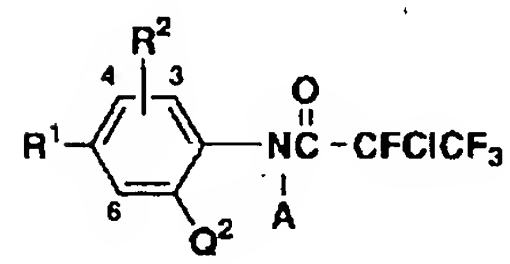
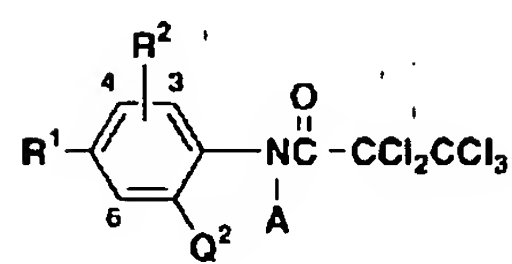
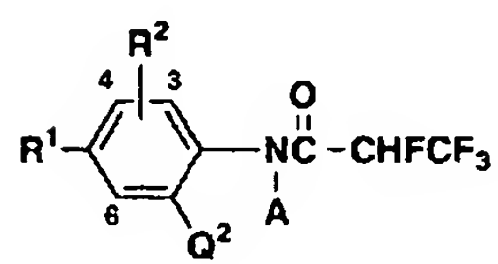
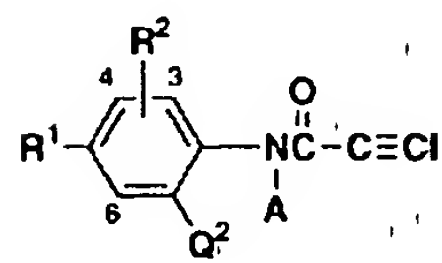
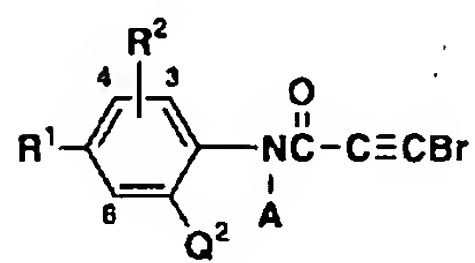
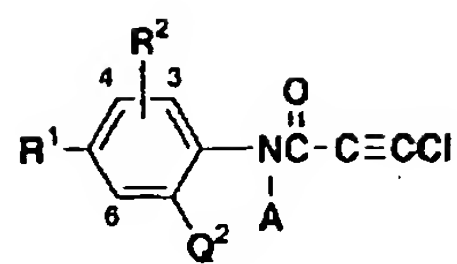
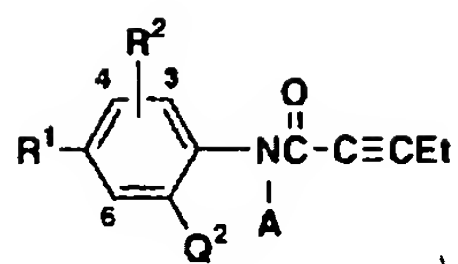


[0159]

[化81]

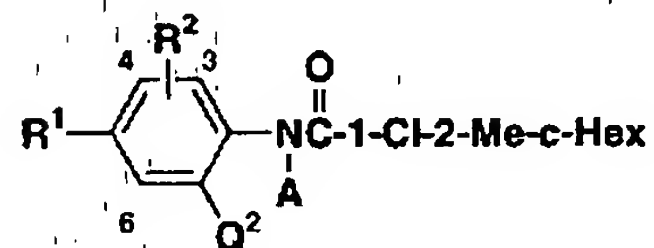
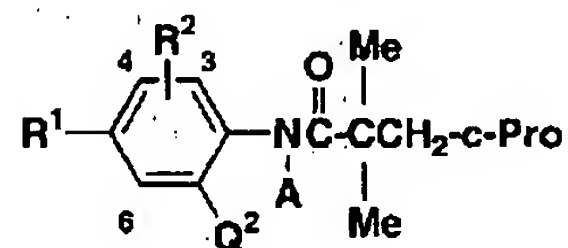
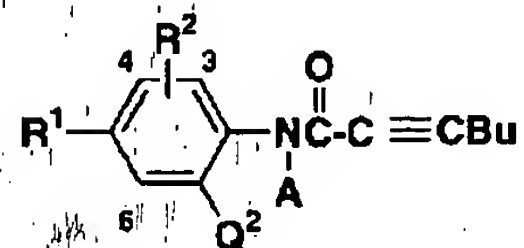
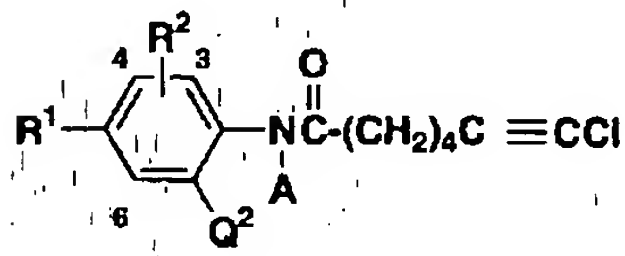
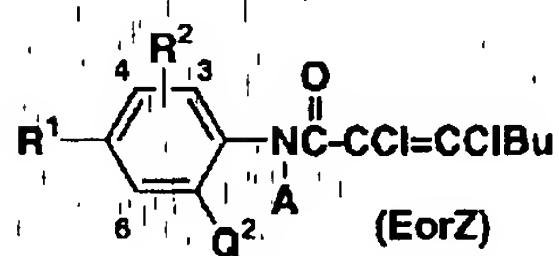
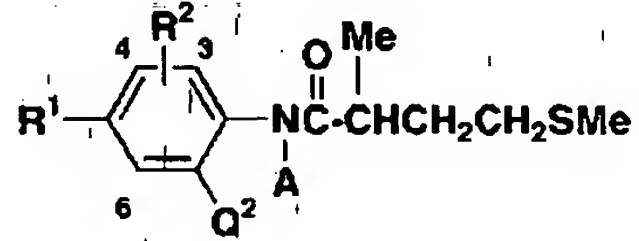
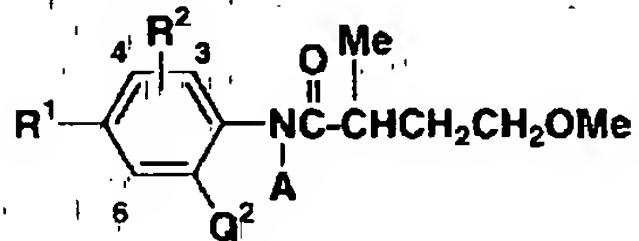
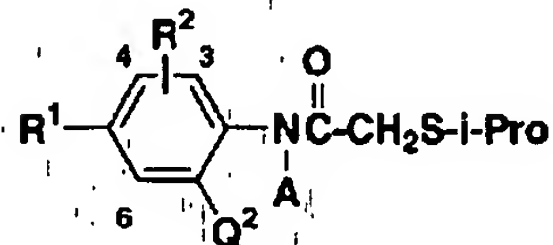
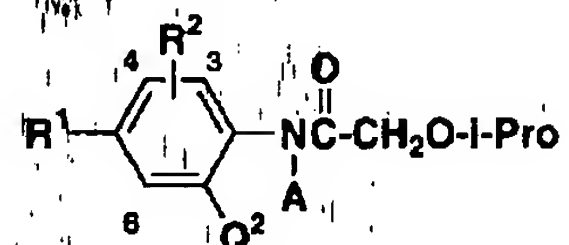
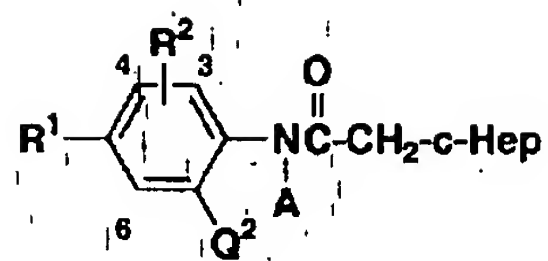
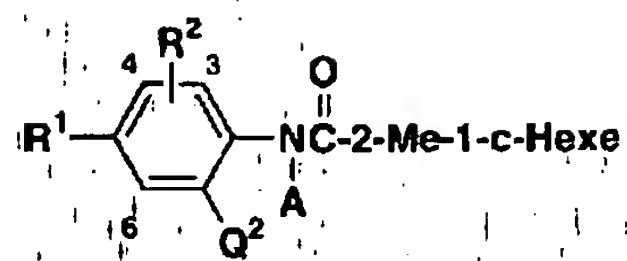


【0160】



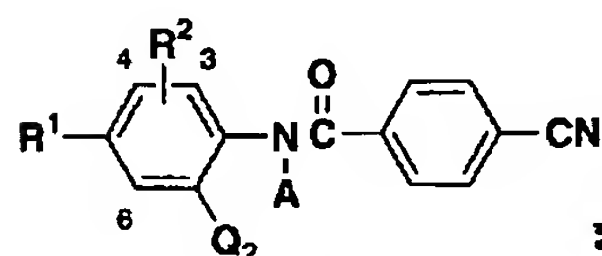
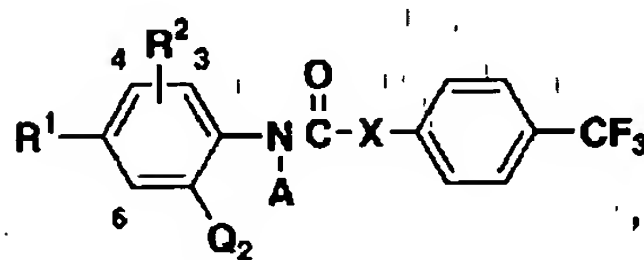
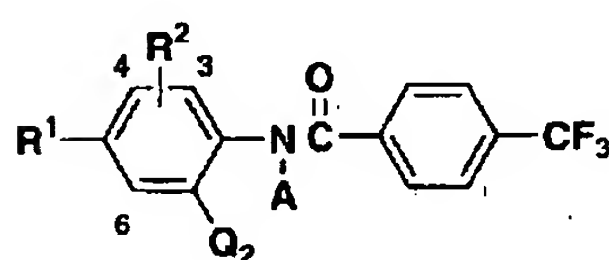
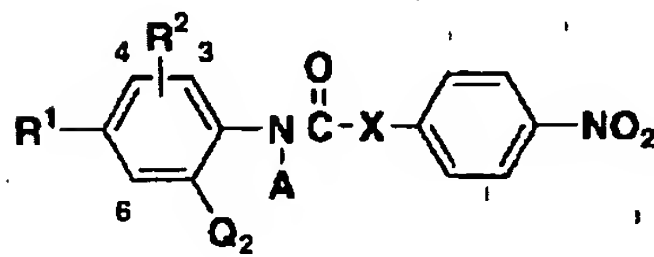
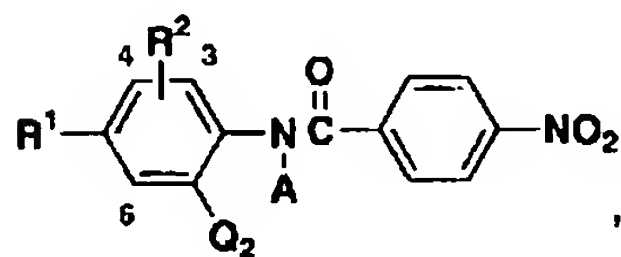
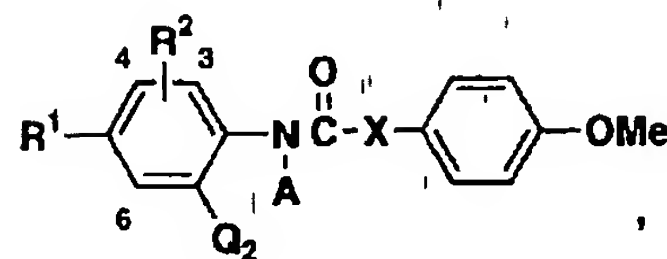
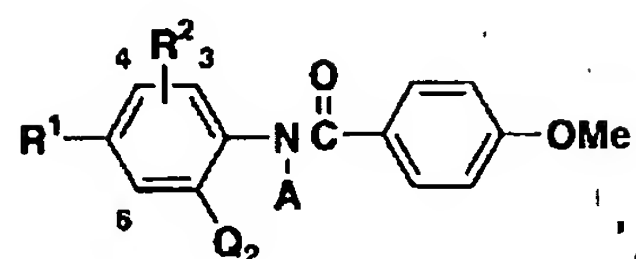
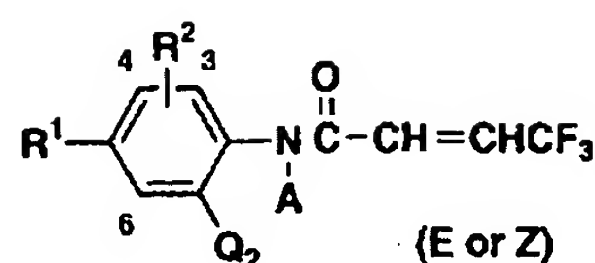
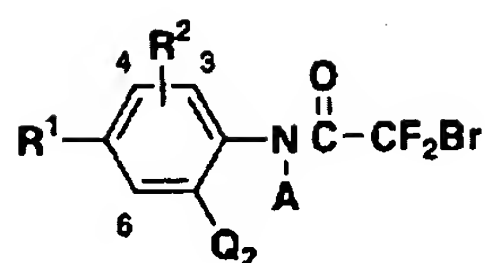
【0161】

【化83】

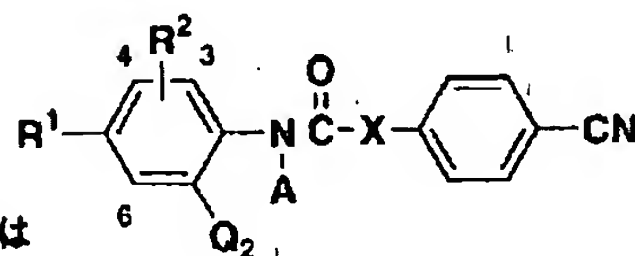


【0162】

【化84】



または



【0163】但し、AはH、CHO、MeCO、EtCO、ProCO、i-ProCO、BuCO、i-BuCO、s-BuCO、t-BuCO、CF₃CO、CF₂ClCO、CCl₃CO、CHCl₂CO、C₂F₅CO、CF₃CH₂CO、MeCHClCO、CHF₂CF₂CO、CF₂ClCF₂CO、EtCHClCO、i-ProCHBrCO、CO₂Me、CO₂Et、CO₂Pro、CO₂i-Pro、CO₂Bu、CO₂t-Bu、CO₂CH₂CF₃、CO₂CH(CF₃)₂、CO₂(CH₂)₄Cl、CH₂=CHCO、CH₂=CMeCO、MeCH=CHCO (E or Z)、Me₂C=CHCO、C(O)SMe、C(O)SEt、C(O)SBu、c-ProCO、1-Me-c-ProCO、2-Me-c-ProCO、c-Bu

CO、c-PenCO、c-HexCO、CO₂c-Pro、CO₂c-Pen、CO₂c-Hex、MeS、EtS、BuS、MeSO、EtSO、BuSO、MeSO₂、EtSO₂、ProSO₂、BuSO₂、CCl₃S、CF₃S、CF₂ClS、C₂F₅S、CF₃(CF₂)₃S、CCl₃SO、CF₃SO、CF₂ClSO、C₂F₅SO、CF₃(CF₂)₃SO、CCl₃SO₂、CF₃SO₂、CF₂ClSO₂、C₂F₅SO₂またはCF₃(CF₂)₃SO₂を示し、XはO、S、NH、MeN、EtN、ProNまたはiso-ProNを示す。

【0164】

【表33】

R ¹	R ²	Q ²
Me	H	3-Cl-Q-2
Me	H	3,5-Cl ₂ -Q-2
Me	H	3-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	3,4-Cl ₂ -Q-2
Me	H	3,5-Cl ₂ -Q-2
Me	H	3,5-Cl ₂ -4-CO ₂ Me-Q-2

Me	H	3-Br-Q-2
Me	H	4-Cl-Q-2
Me	H	3-Me-4-Cl-Q-2
Me	H	3-i-Pro-5-Cl-Q-2
Me	H	3-t-Bu-5-Cl-Q-2
Me	H	3-CN-Q-2
Me	H	3-CN-5-Cl-Q-2
Me	H	3-CN-5-Me-Q-2
Me	H	3-CN-4-Cl-Q-2
Me	H	4-CN-Q-2
Me	H	3-Cl-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	3-CCl ₃ -Q-2
Me	H	3-CCl ₃ -5-Cl-Q-2
Me	H	3-CCl ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	3-CCl ₃ -5-Et-Q-2
Me	H	3-CF ₂ Cl-Q-2
Me	H	3-CF ₂ Cl-5-Cl-Q-2

【0165】

【表34】

R ¹	R ²	Q ²
Me	H	3-CF ₂ Cl-5-Me-Q-2
Me	H	3-CF ₂ Cl-5-Et-Q-2
Me	H	3-CF ₂ Cl-5-F-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -5-Et-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -5-F-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -4-Cl-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -4-NO ₂ -Q-2
Me	H	3-CF ₃ -4-Me-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -5-OMe-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -4,5-Me ₂ -Q-2
Me	H	3-CF ₃ -4-CO ₂ Me-5-Cl-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -5-Br-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -4-Br-Q-2
Me	H	3,5-(CF ₃) ₂ -Q-2
Me	H	3-C ₂ F ₅ -Q-2
Me	H	3-C ₂ F ₅ -5-Cl-Q-2
Me	H	3-C ₂ F ₅ -5-Me-Q-2
Me	H	3-C ₂ F ₅ -5-Et-Q-2
Me	H	3-C ₂ F ₅ -5-F-Q-2

【0166】

【表35】

R ¹	R ²	Q ²
----------------	----------------	----------------

Me	H	3-C ₂ F ₅ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	3-C ₂ F ₅ -4-Cl-Q-2
Me	H	3-CF ₃ CH ₂ -Q-2
Me	H	3-CF ₃ CH ₂ -5-Cl-Q-2
Me	H	3-CF ₃ CH ₂ -5-Me-Q-2
Me	H	3-CF ₃ CH ₂ -5-Et-Q-2
Me	H	3-CF ₃ CH ₂ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	3-OCF ₃ -Q-2
Me	H	3-OCF ₃ -5-Cl-Q-2
Me	H	3-OCF ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	3-OCF ₃ -5-Et-Q-2
Me	H	3-OCF ₃ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	3-OCHF ₂ -Q-2
Me	H	3-OCHF ₂ -5-Cl-Q-2
Me	H	3-OCHF ₂ -5-Me-Q-2
Me	H	3-OCHF ₂ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	3-C ₃ F ₇ -Q-2
Me	H	3-C ₃ F ₇ -5-Cl-Q-2
Me	H	3-C ₃ F ₇ -5-Me-Q-2
Me	H	3-Me-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	3,5-Me ₂ -4-NO ₂ -Q-2
Me	H	3-i-Pro-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	3-i-Pro-4-Cl-Q-2

【0167】

【表36】

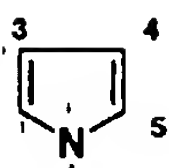
R ¹	R ²	Q ²
Me	H	3-t-Bu-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	3-t-Bu-4-Cl-Q-2
Me	3-Cl	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-Cl	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	3-Me	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-Me	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	3-NO ₂	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-NO ₂	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	3-OMe	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-OMe	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	4-NO ₂	3-CF ₃ -Q-2
Me	4-NO ₂	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Cl	H	3-CF ₃ -Q-2
Cl	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
Cl	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Et	H	3-CF ₃ -Q-2
Et	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
Et	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
OMe	H	3-CF ₃ -Q-2
OMe	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
OMe	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
SMe	H	3-CF ₃ -Q-2

【0168】

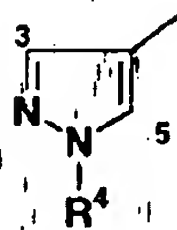
SMe	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
【表37】		
R ¹	R ²	Q ²
SMe	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	5-CF ₃ -Q-3(R ⁴ :H)
Me	H	5-CF ₃ -Q-3(R ⁴ :Me)
Me	H	5-CF ₃ -4-Cl-Q-3(R ⁴ :Me)
Me	H	5-CF ₃ -4-Me-Q-3(R ⁴ :Me)
Cl	H	5-CF ₃ -Q-3(R ⁴ :Me)
Me	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-4(R ⁴ :Me)
Me	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-4(R ⁴ :H)
Me	H	3-Me-5-CF ₃ -Q-4(R ⁴ :Me)
Me	H	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :H)
Me	H	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
Cl	H	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
Me	H	5-CF ₃ -Q-15
Me	H	5-CF ₃ -4-Me-Q-15
Cl	H	5-CF ₃ -Q-15
Me	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-16
Me	H	3-Me-5-CF ₃ -Q-16
Me	H	3-CF ₃ -Q-17
Me	H	3-CF ₃ -4-Me-Q-17
Cl	H	3-CF ₃ -Q-17

【0169】但し、表3及び表4中のQ-1～Q-32
は下記を表す。

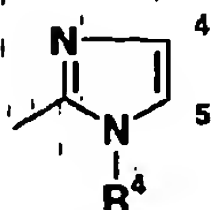
【0170】
【化85】



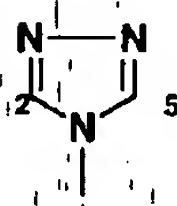
Q-1



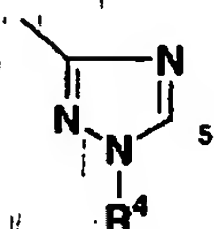
Q-4



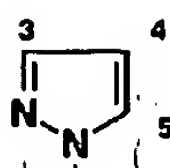
Q-7



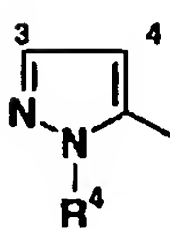
Q-10



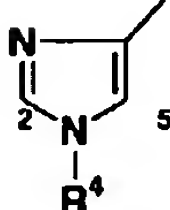
Q-13



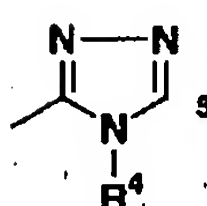
Q-2



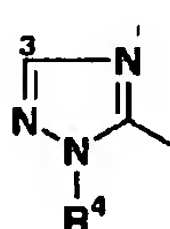
Q-5



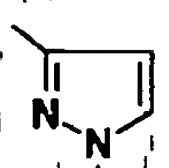
Q-8



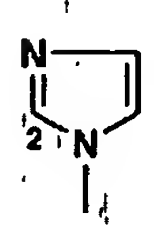
Q-11



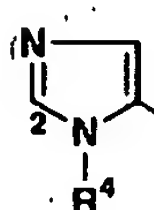
Q-14



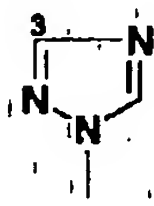
Q-3



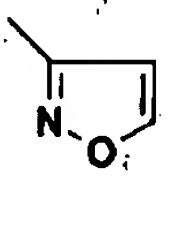
Q-6



Q-9



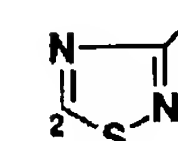
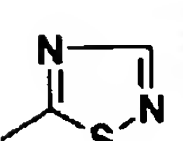
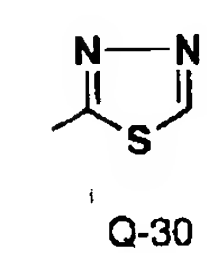
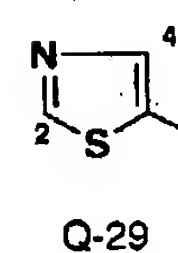
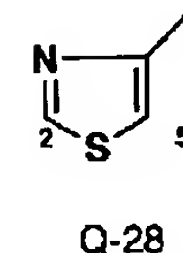
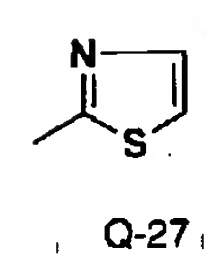
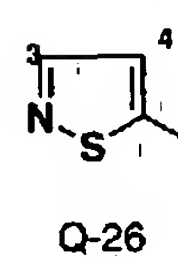
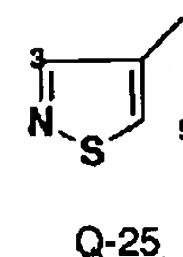
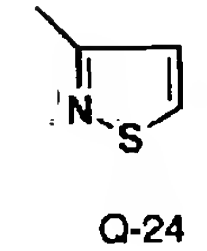
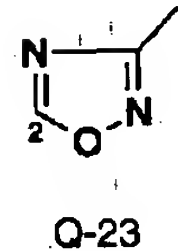
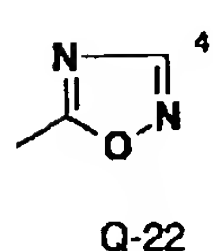
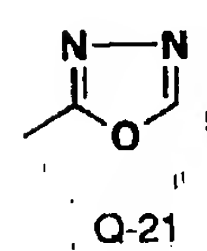
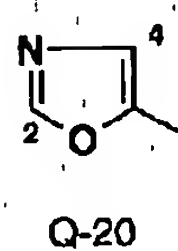
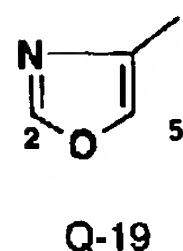
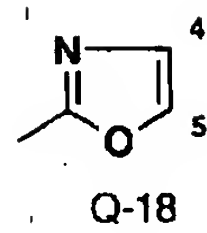
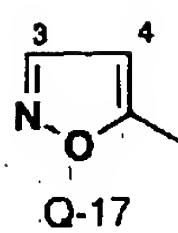
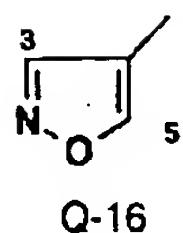
Q-12



Q-15

【0171】

【化86】



【0172】本発明化合物を除草剤として施用するに当たっては、一般には適当な担体、例えばクレー、タルク、ベントナイト、珪藻土、ホワイトカーボン等の固体担体あるいは水、アルコール類（イソプロパノール、ブタノール、ベンジルアルコール、フリフリルアルコール等）、芳香族炭化水素類（トルエン、キシレン等）、エーテル類（アニソール類）、ケトン類（シクロヘキサノン、イソホロン類）、エステル類（酢酸ブチル類）、酸アミド類（N-メチルピロリドン等）またはハロゲン化炭化水素類（クロルベンゼン等）などの液体担体と混用して適用することができ、所望により界面活性剤、乳化剤、分散剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、固結防止剤、安定剤などを添加し、液剤、乳剤、水和剤、ドライフロアブル剤、フロアブル剤、粉剤、粒剤等任意の剤型にて実用に供することができる。

【0173】また、本発明化合物は必要に応じて製剤または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤などと混合施用しても良い。特に、他の雑草剤と混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺草スペクトラムの拡大や、より高い殺草効果が期待できる。この際、同時に複数の公知除草剤との組み合わせも可能で

ある。本発明化合物と混合使用する除草剤の種類としては、例えば、ファーム・ケミカルズ・ハンドブック (Farm Chemicals Handbook)、1995年版に記載されている化合物などがある。

【0174】本発明化合物の除草剤としての施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール(ha)当たり0.0001~10kg程度、好ましくは0.001~5kg程度が適当である。次に具体的に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

【0175】〔水和剤〕

発明化合物	5~80部
固体担体	10~85部
界面活性剤	1~10部
その他	1~5部

その他として、例えば固結防止剤などがあげられる。

【0176】〔乳剤〕

本発明化合物	1~30部
液体担体	55~95部
界面活性剤	4~15部

〔フロアブル剤〕

本発明化合物	5～70部
液体担体	15～65部
界面活性剤	5～12部
その他	5～30部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等があげられる。

【0177】〔粒状水和剤（ドライフロアブル剤）〕

本発明化合物	20～90部
固体担体	9～60部
界面活性剤	1～20部

〔粒剤〕

本発明化合物	0.01～10部
固体担体	90～99.99部
その他	0～5部

〔配合例1〕水和剤

本発明化合物 No. C-55	50部
ジークライト PF	43部
(カオリン系クレー：ジークライト工業 (株) 商品名)	
ソルポール 5050	2部
(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業 (株) 商品名)	
ルノックス 1000C	3部

(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業 (株) 商品名)

カープレックス #80 (固結防止剤)	2部
(ホホワイトカーボン：塩野義製薬 (株) 商品名)	

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

【0178】〔配合例2〕乳剤

本発明化合物 No. C-46	3部
キシレン	76部
イソホロン	15部
ホルポール 3005X	6部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業 (株) 商品名)

以上を均一に混合して乳剤とする。

【0179】〔配合例3〕フロアブル剤

本発明化合物 No. C-4	35部
アグリゾール S-711	8部
(非イオン性界面活性剤：花王 (株) 商品名)	
ルノックス 1000C	0.5部
(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業 (株) 商品名)	
1%ロドポール水	20部

(増粘剤：ローン・プーラン社商品名)

エチレングリコール (凍結防止剤)	8部
水	28.5部

以上を均一に混合して、フロアブル剤とする。

【0180】

〔配合例4〕粒状水和剤（ドライフロアブル剤）

本発明化合物 No. C-31	75部
イソバン No. 1	10部
(アニオン性界面活性剤：クラレイソブレンケミカル	

(株) 商品名)

バニレックス N	5部
----------	----

(アニオン性界面活性剤：山陽国策パルプ (株) 商品名)

カープレックス #80	10部
-------------	-----

(ホホワイトカーボン：塩野義製薬 (株) 商品名)

以上を均一に混合微粉碎してドライフロアブル剤とする。

【0181】〔配合例5〕粒剤

本発明化合物 No. C-20	0.1部
ベントナイト	55.0部
タルク	44.9部

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合捏和し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粉剤にする。

【0182】使用に際しては上記水和剤、乳剤、フロアブル剤、粒状水和剤は水で50～1000倍に希釈して、有効成分が1～10,000ppm、もしくは有効成分が1ヘクタール(ha)当たり0.0001～10kgになるように散布する。次に、本発明化合物の除草剤としての有用性を以下の試験例において具体的に説明する。

【0183】〔試験例1〕土壌処理による除草剤効果試験

縦21cm、横13cm、深さ7cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、ノビエ(A)、エノコログサ(B)、イチビ(C)、アオビユ(D)、アサガオ(E)、トウモロコシ(a)、ダイズ(b)およびワタ(c)の種子をそれぞれスポット状に播種し、約1.5cm覆土した後、本発明化合物の有効成分量が所定の割合になるように土壌表面へ小型スプレーで均一に散布した。散布の際の薬液は、前記配合例等に準じて適宜調整された水和剤を水で希釈して用いた。薬液散布3週間後に作物および雑草に対する除草効果を下記の判定基準に従い調査した。抑制の程度は肉眼による観察調査から求めた。結果を表5に示す。

【0184】5: 完全枯死あるいは90%以上の抑制

4: 70%～90%の抑制

3: 40%～70%の抑制

2: 20%～40%の抑制

1: 5%～20%の抑制

0: 5%未満の抑制

【0185】〔試験例2〕茎葉処理による除草効果試験

縦21cm、横13cm、深さ7cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、ノビエ(A)、エノコログサ(B)、イチビ(C)、アオビユ(D)、アサガオ(E)およびオナモミ(F)の種子をそれぞれスポット状に播種し、約1.5cm覆土した。各植物が2～3葉期に達したとき、本発明化合物の有効成分量が所定の割合になるように茎葉部へ小型スプレーで均一に散布した。散布の際の薬液は、前記配合例等に準じて適宜調整された水和剤を水で希釈して用いた。薬液散布3週間後に雑草に対する除草効果を試験例1の

判定基準に従い調査した。結果を表6に示す。

【0186】〔試験例3〕湛水条件による除草効果試験
1/10000アールのワグネルポット中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深4cmの湛水条件にした。ノビエ(A)、ホタルイ(G)、コナギ(H)およびキカシグサ(I)の種子を上記のポットに播種した後、2.5葉期のイネ苗(d)を移植した。播種1日後に、本発明化合物の有効成分量が所定の割合になるように、水面へメスピペットで滴下処理した。滴下の際の薬液は、前記配合例等に応じて適宜調整した水和剤を希釈して用いた。ポットを25～30℃の温室内に置いて植物を育成し、薬液滴下後3週間目にイネおよび雑草に対する除草効果を試験例1の判定基準に従い調査した。結果を表7に示す。

【0187】

【表38】〔表5〕

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	a	b	c
C-1	0.63	5	5	5	5	5	5	0	0
C-2	2.5	5	5	0	2	4	2	0	0
C-3	2.5	5	5	0	0	1	0	0	0
C-4	0.63	5	5	5	5	5	4	0	0
C-5	2.5	5	5	5	5	5	2	0	0
C-8	0.63	5	5	4	5	5	2	0	4
C-9	2.5	5	5	0	5	4	0	0	0
C-10	2.5	5	5	5	5	5	2	0	0
C-12	2.5	5	5	5	5	4	0	0	0
C-16	0.63	5	5	5	5	2	0	0	0
C-17	0.63	5	5	5	4	4	0	0	0
C-20	2.5	5	5	5	5	5	2	0	0
C-31	0.63	5	5	5	5	5	1	2	0
C-32	0.63	5	5	5	5	5	0	0	0
C-39	0.63	5	5	5	5	5	0	0	0
C-44	0.63	5	5	4	4	4	0	0	0
C-46	0.63	5	5	2	5	4	0	0	0
C-54	0.63	5	5	5	5	0	2	0	0
C-55	0.63	5	5	5	5	1	1	0	0
C-57	2.5	5	5	5	5	5	3	1	0
C-58	0.63	5	5	0	5	4	0	0	0
C-59	2.5	5	5	5	5	5	3	0	0

【0188】

【表39】

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	a	b	c
C-60	0.63	5	5	0	5	5	2	0	0
C-62	2.5	5	5	2	5	5	1	0	0
C-68	0.63	5	5	5	5	5	1	0	2
C-72	0.63	5	5	5	5	2	2	0	1

C-77	0.63	5	5	5	5	3	0	0	0
C-79	2.5	5	5	5	5	5	0	0	0
C-80	2.5	5	5	5	5	5	2	0	0
C-84	0.63	5	5	5	5	2	0	3	2
C-85	0.63	5	5	5	5	3	0	3	0
C-86	0.63	5	5	5	5	4	3	1	5
C-87	0.63	5	5	5	5	5	1	3	5
C-88	2.5	5	5	5	5	3	3	0	3
C-89	0.63	5	5	5	5	5	3	0	4
C-90	0.63	5	5	5	5	5	1	0	0
C-91	0.63	5	5	5	5	5	3	3	4
C-92	0.63	5	5	5	5	5	2	3	0
C-93	0.63	5	5	5	5	5	3	0	0
C-94	0.63	5	5	5	5	2	0	0	0
C-97	0.63	5	5	5	5	5	3	3	0
C-98	0.63	5	5	0	5	2	3	0	0
C-99	0.63	5	5	5	0	0	3	0	0
C-100	2.5	5	5	5	5	4	3	0	0
C-101	2.5	5	5	5	5	5	2	0	0

【0189】

【表40】

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	a	b	c
C-103	2.5	5	5	0	0	0	2	0	0
C-104	2.5	5	5	5	5	5	0	0	0
C-105	0.63	5	5	5	5	5	2	0	0
C-106	0.63	5	4	5	5	5	2	0	0
C-108	2.5	5	5	1	1	1	0	0	0
C-110	2.5	5	5	5	5	1	0	0	0
C-111	2.5	5	5	5	5	5	3	4	0
C-113	2.5	5	5	5	5	4	0	0	0
C-118	2.5	5	5	5	5	5	3	3	4
C-119	0.63	5	5	5	5	4	0	0	0
C-120	0.63	5	5	5	5	5	2	0	0
C-122	2.5	5	5	5	0	5	1	0	0
C-123	2.5	5	5	2	5	1	3	0	0
C-124	0.63	5	5	5	5	5	3	0	0
C-125	0.63	5	5	4	5	4	2	0	0
C-126	2.5	5	5	5	5	5	1	0	0
C-135	2.5	4	5	5	5	0	2	0	0
C-137	0.63	5	5	5	5	5	3	0	0
C-140	0.63	5	5	5	5	5	0	0	0
C-141	0.63	5	5	5	5	5	3	0	0
C-143	0.63	5	5	5	5	5	2	0	0
C-144	0.63	5	5	5	5	5	3	2	0
C-145	0.63	5	5	5	5	1	0	0	0

【0190】

【表 4 1】

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	a	b	c
C-146	2.5	5	5	5	5	5	2	0	5
C-147	0.63	5	5	5	5	5	3	3	2
C-148	2.5	5	5	5	5	5	3	3	4
C-150	2.5	5	5	5	5	5	1	0	1
C-151	2.5	5	5	5	5	5	3	0	1
C-152	2.5	5	5	5	5	4	3	2	0
C-153	0.63	5	5	5	5	5	2	2	2
C-154	2.5	5	5	5	5	5	3	3	0
C-155	2.5	5	5	5	5	5	3	3	3
C-157	2.5	5	5	5	5	5	0	0	0
C-158	0.63	5	5	5	5	5	3	0	2
C-159	0.63	5	5	5	5	5	3	2	0
C-160	2.5	5	5	5	5	5	3	2	0
C-161	2.5	5	5	5	5	2	2	0	0
C-163	2.5	5	5	5	5	5	3	0	0
C-165	0.63	5	5	5	5	5	3	3	0
C-166	2.5	5	5	5	5	5	2	0	0
C-168	0.63	5	5	5	5	5	0	0	2
D-1	0.63	5	5	5	5	5	3	4	5
D-2	0.63	5	5	5	2	4	0	2	0
D-3	0.63	5	5	5	5	4	2	3	0
D-4	0.63	5	5	5	5	5	3	4	2
D-5	0.63	5	5	5	5	5	3	3	3

【0 1 9 1】

【表 4 2】

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	a	b	c
D-6	2.5	5	5	5	5	5	3	3	3
D-7	2.5	5	5	5	5	5	3	3	0
D-8	0.63	5	5	5	5	5	3	0	0
D-9	2.5	5	5	5	5	5	2	0	0
D-10	2.5	5	5	5	5	5	0	0	0
D-11	0.63	5	5	5	5	5	3	0	1
D-12	0.63	5	5	5	5	5	3	4	4
D-13	2.5	5	5	5	5	5	0	0	0
D-14	0.63	5	5	5	5	5	4	3	0
D-15	2.5	5	5	5	5	5	3	3	0
D-16	0.63	5	5	5	5	5	3	5	3
D-17	0.63	5	5	5	5	5	3	0	0
D-18	0.63	5	5	5	5	5	3	4	0
D-19	0.63	5	5	5	5	5	4	4	3
D-20	0.63	5	5	5	5	5	3	3	0
D-21	0.63	5	5	5	5	5	3	3	0

【0 1 9 2】

【表 4 3】 【表 6】

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	F
C-4	2.5	5	5	5	3	5	4
C-5	2.5	5	5	5	4	5	2
C-8	2.5	5	4	5	5	4	5
C-10	2.5	5	5	5	2	5	4
C-31	0.63	5	5	4	2	5	4
C-32	0.63	5	5	4	3	5	3
C-54	2.5	5	5	5	5	5	5
C-55	2.5	5	5	4	2	5	1
C-57	2.5	5	5	4	4	5	4
C-58	2.5	5	5	5	4	4	0
C-59	2.5	5	5	5	5	5	4
C-60	2.5	5	5	2	5	5	4
C-61	2.5	5	5	5	5	5	5
C-68	0.63	5	5	5	5	5	5
C-72	0.63	5	5	4	2	4	0
C-77	2.5	5	5	4	4	4	2
C-80	2.5	5	5	4	2	4	2
C-84	2.5	5	5	5	5	5	5
C-85	2.5	5	5	5	5	5	4
C-86	2.5	5	5	5	5	5	2
C-87	2.5	5	5	5	5	5	5
C-88	2.5	5	5	5	4	4	0

【0 1 9 3】

【表 4 4】

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	F
C-89	2.5	5	5	5	4	5	4
C-90	2.5	5	5	4	4	5	4
C-91	2.5	5	5	4	4	5	4
C-92	2.5	5	5	5	2	5	3
C-93	0.63	5	5	4	4	4	4
C-97	2.5	4	4	4	4	5	4
C-98	2.5	5	5	4	5	-	-
C-105	2.5	5	5	4	2	5	0
C-119	2.5	5	5	4	4	5	4
C-120	0.63	5	5	5	4	4	2
C-122	2.5	5	5	5	3	5	0
C-124	2.5	5	5	5	5	5	1
C-125	2.5	5	5	4	4	4	1
C-137	2.5	4	5	5	5	5	5
C-141	2.5	5	5	5	5	5	0
C-143	2.5	5	5	4	2	4	4
C-147	2.5	5	5	5	4	5	4

C-158	2.5	5	5	5	5	4	4
C-159	2.5	5	5	5	4	5	4
D-1	2.5	5	5	4	4	5	5
D-8	2.5	5	5	5	3	3	4
D-11	2.5	5	5	5	3	5	5
D-12	2.5	5	5	5	4	5	5

【0194】

【表45】

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	F
D-14	2.5	5	5	4	4	5	5
D-15	2.5	5	5	5	4	5	5
D-16	2.5	5	5	4	4	4	4
D-19	0.63	5	5	4	4	4	4
D-21	2.5	5	5	4	4	4	4

【0195】

【表46】 【表7】

No.	薬量 kg/ha	A	G	H	I	d
C-1	0.25	5	5	5	5	0
C-2	1.0	5	5	5	5	0
C-3	1.0	5	4	5	5	0
C-4	0.25	5	5	5	5	0
C-5	1.0	5	5	5	5	0
C-6	1.0	5	5	5	5	0
C-7	1.0	5	5	5	5	0
C-8	0.25	5	5	5	5	0
C-9	1.0	5	5	5	5	0
C-10	0.25	5	5	5	5	0
C-12	1.0	5	5	5	5	0
C-16	0.25	5	5	5	5	0
C-20	1.0	5	5	5	5	0
C-26	0.25	5	5	5	5	0
C-31	0.25	5	5	5	5	1
C-32	0.25	5	5	5	5	0
C-39	0.25	5	5	5	5	0
C-41	0.25	5	5	5	5	0
C-42	0.25	5	5	5	5	0
C-44	0.25	5	5	5	5	0
C-45	0.25	5	5	5	5	0
C-46	0.25	5	5	5	5	1

【0196】

【表47】

No.	薬量 kg/ha	A	G	H	I	d
-----	----------	---	---	---	---	---

C-47	1.0	5	5	5	5	0
C-49	1.0	5	2	5	5	0
C-50	1.0	5	4	5	5	0
C-54	1.0	5	5	5	5	0
C-55	1.0	5	5	5	5	0
C-56	1.0	5	5	5	5	0
C-57	1.0	5	5	5	5	2
C-58	1.0	5	5	5	5	0
C-59	1.0	5	5	5	5	0
C-60	1.0	5	5	5	5	0
C-61	1.0	5	5	5	5	0
C-62	1.0	5	5	5	5	0
C-67	0.25	5	5	5	5	0
C-68	0.25	5	5	5	5	0
C-69	0.25	5	5	5	5	0
C-72	0.25	5	5	5	5	0
C-73	0.25	5	5	5	5	0
C-74	0.25	5	4	5	5	0
C-77	1.0	5	5	5	5	0
C-79	1.0	5	5	5	5	0
C-80	1.0	5	5	5	5	0
C-84	1.0	5	5	5	5	0
C-85	1.0	5	5	5	5	0

【0197】

【表48】

No.	薬量 kg/ha	A	G	H	I	d
C-86	1.0	5	5	5	5	0
C-87	0.25	5	5	5	5	0
C-88	0.25	5	5	5	5	0
C-89	0.25	5	5	5	5	0
C-90	0.25	5	5	5	5	0
C-91	0.25	5	5	5	5	0
C-92	0.25	5	5	5	5	0
C-93	0.25	5	5	5	5	0
C-94	0.25	5	5	5	5	0
C-96	0.25	5	5	5	5	0
C-97	0.25	5	5	5	5	0
C-98	0.25	5	5	5	5	0
C-99	0.25	5	5	5	5	0
C-100	0.25	5	5	5	5	0
C-101	0.25	5	5	5	5	0
C-102	0.25	5	5	5	5	0
C-103	0.25	5	5	5	5	0
C-104	0.25	5	5	5	5	0
C-105	0.25	5	5	5	5	0
C-106	0.25	5	5	5	5	0

C-108	0.25	5	5	5	5	0
C-110	1	5	5	5	5	0
C-111	1	5	5	5	5	0

【0198】

【表49】

No.	薬量 kg/ha	A	G	H	I	d
C-113	0.25	5	5	5	5	0
C-115	1	5	5	5	5	0
C-116	1	5	4	5	5	0
C-117	1	5	5	5	5	0
C-118	0.25	5	5	5	5	0
C-119	0.25	5	5	5	5	0
C-120	0.25	5	5	5	5	0
C-121	0.25	5	5	5	5	0
C-122	0.25	5	5	5	5	0
C-123	1	5	5	5	5	0
C-124	0.25	5	5	5	5	0
C-125	0.25	5	5	5	5	0
C-126	1	5	5	5	5	0
C-127	1	5	5	5	5	0
C-128	0.25	5	5	5	5	0
C-132	1	3	5	5	5	0
C-134	1	5	5	5	5	0
C-135	1	5	5	5	5	0
C-137	0.25	5	5	5	5	0
C-139	1	5	5	5	5	0
C-140	0.25	5	5	5	5	0
C-141	0.25	5	5	5	5	0
C-143	0.25	5	5	5	5	0

【0199】

【表50】

No.	薬量 kg/ha	A	G	H	I	d
C-144	0.25	5	5	5	5	0
C-145	0.25	5	5	5	5	0
C-146	0.25	5	5	5	5	0
C-147	0.25	5	5	5	5	0
C-148	1	5	5	5	5	0
C-149	1	5	5	5	5	0
C-150	0.25	5	5	5	5	0

C-151	0.25	5	5	5	5	0
C-152	1	5	5	5	5	0
C-153	1	5	5	5	5	0
C-154	1	5	5	5	5	0
C-155	1	5	5	5	5	0
C-156	0.25	5	5	5	5	0
C-157	0.25	5	5	5	5	0
C-158	0.25	5	5	5	5	0
C-159	0.25	5	5	5	5	0
C-160	0.25	5	5	5	5	0
C-161	0.25	5	5	5	5	0
C-162	1	5	4	5	5	0
C-163	0.25	5	5	5	5	0
C-164	1	5	4	5	5	0
C-165	0.25	5	5	5	5	0
C-166	0.25	5	5	5	5	0

【0200】

【表51】

No.	薬量 kg/ha	A	G	H	I	d
C-167	1	5	5	5	5	0
C-168	0.25	5	5	5	5	0
D-1	0.25	5	5	5	5	0
D-2	0.25	5	5	5	5	0
D-3	0.25	5	5	5	5	0
D-4	0.25	5	5	5	5	0
D-5	0.25	5	5	5	5	0
D-6	0.25	5	5	5	5	0
D-7	0.25	5	5	5	5	0
D-8	0.25	5	5	5	5	0
D-9	1	5	5	5	5	0
D-11	0.25	5	5	5	5	0
D-12	0.25	5	5	5	5	0
D-13	1	5	5	5	5	0
D-14	0.25	5	5	5	5	0
D-15	0.25	5	5	5	5	0
D-16	0.25	5	5	5	5	0
D-17	0.25	5	5	5	5	0
D-18	0.25	5	5	5	5	0
D-19	0.25	5	5	5	5	0
D-20	0.25	5	5	5	5	0
D-21	0.25	5	5	5	5	0

フロントページの続き

(51) Int. Cl. ⁶	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A O 1 N 43/76			A O 1 N 43/76	
43/78			43/78	B
43/80	1 0 1		43/80	1 0 1
	1 0 2			1 0 2
43/824			C O 7 D 207/33	
43/836			207/34	
C O 7 D 207/33			231/12	B
207/34				C
231/12			233/64	1 0 2
			233/68	
233/64	1 0 2		249/02	
233/68			249/08	
249/02			261/08	
249/08			263/32	
261/08			271/06	
263/32			271/10	
271/06			275/02	
271/10			277/22	
275/02			285/08	
277/22			A O 1 N 43/82	1 0 1
285/08				1 0 4
285/12			C O 7 D 285/12	A
(72) 発明者 沢田 寛司			(72) 発明者 縄巻 勤	
千葉県船橋市坪井町722番地 1 日産化学工			埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化	
業株式会社中央研究所内			学工業株式会社生物科学研究所内	
(72) 発明者 玉田 佳丈			(72) 発明者 石川 公広	
千葉県船橋市坪井町722番地 1 日産化学工			埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化	
業株式会社中央研究所内			学工業株式会社生物科学研究所内	
			(72) 発明者 中平 国光	
			埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化	
			学工業株式会社生物科学研究所内	

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☐ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.

THIS PAGE BLANK (USPTO)